



00 97423

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social **BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT**
Organizada bajo las leyes de Alemania ✓

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

Alemania ✓

Departamento o Estado

Dirección

Ciudad

D 51368 Leverkusen

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre **EMILIO FERRERO** ✓

Dirección y Domicilio **Carrera 4 No. 72-35**

Ciudad **Bogotá, Colombia.**

Teléfono **3-47-36-11**

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor(es)

1- Dr. Stefan HERRMANN ✓
3- Dr. Kristian KATHER
5- Dr. Mark-Wilhem DREWES
7- Dr. Dieter FEUCHT

2- Dr. Hans-Jochem RIEBEL
4- Dr. Stefan LEHR
6- Dr. Peter DAHMEN ✓
8- Dr. Rolf PONTZEN

Identificación

1- Vineburgstr. 4a, 40764 Langenfeld, Alemania

2- Heimatstr.1, 56242 Selters, Alemania

3- Grabenstr.21, 40789 Monheim, Alemania

Dirección

4- Ricarda-Huch-Str.38, 40764 Langenfeld, Alemania

5- Goetherstr.88, 40764 Langenfeld, Alemania

6- Altebrücker Str.61, 41470 Neuss, Alemania

Ciudad

7- Ackerweg 9, 40789 Monheim, Alemania

8- Am Kloster 69, 42799 Leichlingen, Alemania

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención **TIENILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS**

PRIORIDAD REIVINDICADA SI ☒ NO ☐ TIPO DE PRIORIDAD ANDINA ☐ UNIONISTA ☒

(33) País

(32) Fecha

(31) No. Solicitud

DE.

24 de Diciembre de 1999 ✓

19962931.5

Convención de París

Para Publicar a los ☐ 6 meses ☐ 12 meses ☒ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

Colo: 00698- 801-136-4 JJC/mrh-ID.906

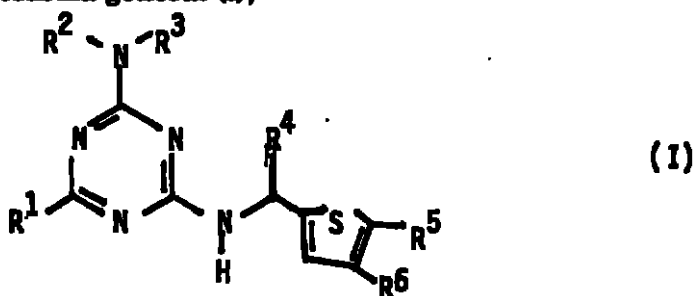
(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

:A-01 N 43/70

22. D.C. 2000

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I),



en la que

R¹, R², R³, R⁴, tienen el significado indicado en la descripción,

R⁵ significa cloro o metilo y

R⁶ significa cloro o metilo,

Estando dispuestos los substituyentes en el átomo de carbono, con el cual está enlazado R⁴, fundamentalmente bien en configuración R o en configuración S. La invención se refiere también a los racetamos correspondientes así como a un procedimiento para la obtención de todos los compuestos según la invención y a su empleo como herbicidas.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica



Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC



Recibo de la tasa respectiva

por v/r de \$608.000.-



Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación



Si se reivindica prioridad Andina:

Copla de la primera solicitud



Traducción oficial



Si se reivindica prioridad Unionista:

Copla certificada de la primera solicitud:

Alemania No. 199629315



Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior

Traducción simple



Capítulo descriptivo



Dibujos, planos necesarios



Capítulo reivindicatorio



Tarjeta archivo propietarios según formato



Tarjeta archivo temático según formato



Extracto para publicación según formato



Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms



Otros Documentos



SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA

Emilio Ferrero

NOMBRE EMILIO FERRERO

CC.

488.019 de Usaquén

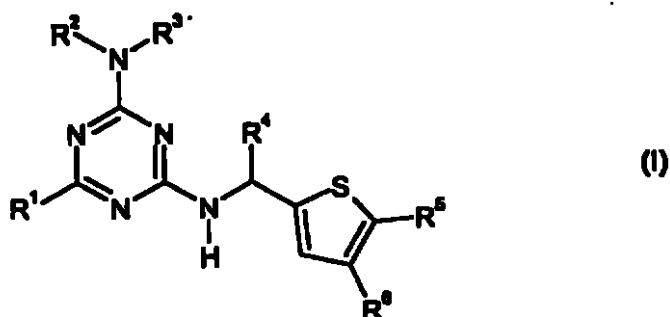
T.P.No. 31.929

TIENILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS.

La invención se refiere a nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas, al procedimiento para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se conoce ya una serie de tienilalquilamino-1,3,5-triazinas por la literatura (de patentes) (véanse las publicaciones JP-A-63222166 - citada en Chem. Abstracts 111:97288w, WO-A-98/15537, WO-A-98/15538, WO-A-98/15539, WO-A-99/18100). Sin embargo estos compuestos no han adquirido hasta ahora ningún significado especial.

Se han encontrado ahora las nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I)



en la que

R¹ significa dihalógenometilo, etilo, halógenoetilo, dihalógenoetilo, n-propilo, halógeno-n-propilo, dihalógeno-n-propilo, i-propilo, halógeno-i-propilo, dihalógeno-i-propilo, halógenociclopropilo, dihalógenociclopropilo o trihalógenociclopropilo,

R² significa hidrógeno o significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,

R³ significa hidrógeno, significa formilo o significa metilo, etilo, n- o i-

propilo, acetilo, propionilo, n- o i-buti-roilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,

R⁵ significa cloro o metilo y

R⁶ significa cloro o metilo,

estando dispuestos los substituyentes sobre el átomo de carbono, con el cual está enlazado R⁴, fundamentalmente bien en configuración R o en configuración S, así como también los racematos correspondientes.

En tanto en cuanto R¹ signifique un substituyente con un átomo de carbono substituido de manera asimétrica, constituyen el objeto de la invención tanto las correspondientes mezclas posibles de diastereómeros así como los diastereómeros individuales posibles.

Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos presentes en las fórmulas anteriormente citadas y que se citarán a continuación, se describen a continuación.

Preferentemente,

R¹ significa difluórmétilo, diclorométilo, dibromométilo, clorofluórmétilo, clorobromométilo, flúorbromométilo, etilo, flúoretilo, cloroetilo, bromoetilo, difluoretilo, dicloroetilo, dibromoetilo, clorofluoretilo, bromofluoretilo, n-propilo, flúor-n-propilo, cloro-n-propilo, bromo-n-propilo, difluor-n-propilo, dicloro-n-propilo, i-propilo, flúor-i-propilo, cloro-i-

propilo, bromo-i-propilo, diflúor-i-propilo, dicloro-i-propilo, flúorciclopropilo, clorociclopropilo, diflúorciclopropilo, diclorociclopropilo, diflúorciclopropilo, triclorociclopropilo, clorodiflúorciclopropilo o flúordiclorociclopropilo.

Preferentemente,

R² significa hidrógeno o significa metilo o etilo substituídos en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente,

R³ significa hidrógeno, significa formilo o significa metilo, etilo, acetilo, propionilo, n- o i-buti-roilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbo-nilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente,

R⁵ significa cloro o metilo.

Preferentemente,

R⁶ significa cloro o metilo.

De forma especialmente preferente,

R¹ significa diflúormetilo, diclorometilo, dibromometilo, cloroflúormetilo, etilo, 1-flúor-etilo, 2-flúor-etilo, 1-cloro-etilo, 2-cloro-etilo, 1-bromo-etilo, 2-bromo-etilo, 1,1-diflúor-etilo, 1,2-diflúor-etilo, 2,2-diflúor-etilo, 1,1-dicloro-etilo, 1,2-dicloro-etilo, 2,2-dicloro-etilo, 1,2-dibromo-etilo, 1-cloro-

1-flúoretilo, 1-cloro-2-flúor-etilo, 2-cloro-1-flúor-etilo, 2-cloro-2-flúor-etilo, 1-flúor-n-propilo, 2-flúor-n-propilo, 1-cloro-n-propilo, 2-cloro-n-propilo, 1-bromo-n-propilo, 2-bromo-n-propilo, 1-flúor-i-propilo, 1-cloro-i-propilo, diflúorciclopropilo o diclorociclopropilo.

De forma especialmente preferente,

R² significa hidrógeno, metilo o etilo.

De forma especialmente preferente,

R³ significa hidrógeno, significa formilo, significa metilo o etilo, o significa acetilo, propionilo, n- o i-butirola, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminarbonilo, etilaminarbonilo, n- o i-propilaminarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁵ significa cloro o metilo.

De forma especialmente preferente,

R⁶ significa cloro o metilo.

De forma muy especialmente preferente.

R¹ significa diflúormetilo, diclorometilo, cloroflúormetilo, etilo, 1-flúor-etilo, 1-cloro-etilo, 1,1-diflúor-etilo, 1,2-diflúor-etilo, 1,1-dicloroetilo, 1,2-dicloroetilo, 1-cloro-1-flúoretilo, 1-cloro-2-flúor-etilo, 2-cloro-1-flúor-etilo, 1-flúor-n-propilo, 1-cloro-n-propilo, 1-flúor-i-propilo o 1-cloro-i-propilo.

De forma muy especialmente preferente,

R² significa hidrógeno.

De forma muy especialmente preferente,

R³ significa hidrógeno, significa formilo o significa acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor,, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro.

De forma my especialmente preferente,

R⁵ significa cloro.

De forma muy especialmente preferente.

R⁶ significa metilo.

Las definiciones de los restos indicadas anteriormente de manera general o citadas en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para los respectivos productos de partida o productos intermedios necesarios para la obtención. Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los intervalos preferentes indicados.

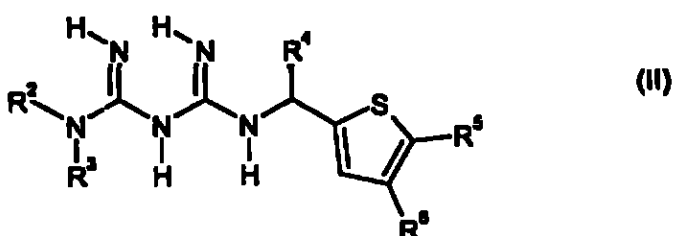
Según la invención son preferentes aquellos restos de la fórmula (I), en los cuales se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera preferente.

Según la invención son especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I), en los cuales se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera especialmente preferente.

Según la invención son muy especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I), en los cuales se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera muy especialmente preferente.

Las nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I) presentan propiedades biológicas interesantes. Se caracterizan, especialmente, por una potente actividad herbicida.

Se obtienen las nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I), si se hacen reaccionar biguanidas de la fórmula general (II)



en la que

R², R³, R⁴, R⁵, y R⁶ tienen el significado anteriormente indicado,

- y/o con ácidos de los compuestos de la fórmula general (II)-
con compuestos de alcoxycarbonilo de la fórmula general (III)



en la que

R¹ tiene el significado anteriormente indicado y

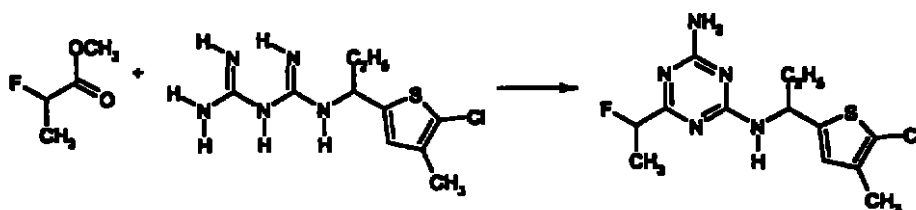
R¹ significa alquilo,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

y en caso dado se llevan a cabo en los compuestos, obtenidos de este modo, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los substituyentes, otras

transformaciones según métodos usuales.

Si se emplean, por ejemplo, la 1-(5-cloro-4-metil-tien-2-il-propil)-biguanida y el 2-flúor-propanoato de metilo como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el procedimiento según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Las biguanidas, a ser empleadas como productos de partida en el procedimiento según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidas en general por medio de la fórmula (II). En la fórmula general (II), R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de forma preferente o bien de forma especialmente preferente para R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula general (I).

Los aductos con ácido adecuados de los compuestos de la fórmula (II) son sus productos de adición con ácidos protónicos, tal como, por ejemplo, con ácido clorhídrico (cloruro de hidrógeno), ácido bromhídrico (bromuro de hidrógeno), ácido sulfúrico, ácido metanosulfónico, ácido bencenosulfónico y ácido p-toluenosulfónico.

Los productos de partida de la fórmula general (II) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las JP-A-

63222166, WO-A-99/18100).

Los compuestos de alcóxicarbonilo, a ser empleados además como productos de partida en el procedimiento según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (III). En la fórmula general (III), R' tiene preferentemente o bien especialmente aquel significado que ya ha sido citado anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para R' en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula general (I); preferentemente R' significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, especialmente significa metilo o etilo.

Los productos de partida de la fórmula general (III) son productos químicos para síntesis conocidos.

El procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se lleva a cabo, preferentemente, con empleo de un diluyente. Como diluyentes para la realización del procedimiento según la invención entran en consideración, además de agua, ante todo disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, especialmente, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como, por ejemplo, bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres tales como dietiléter, diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano o etilenglicoldimetil- o -dietil-éter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutilcetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo o butironitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo,

-10-

sulfóxido, tal como dimetilsulfóxido, alcoholes tales como metanol, etanol, n- o i-propanol, etilenglicolmonometiléter, etilenglicolmonoetiléter, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o agua pura.

Como agentes auxiliares de la reacción para el procedimiento según la invención entran en consideración en general las bases o aceptores de ácido inorgánicos u orgánicos usuales. A éstos pertenecen, preferentemente, acetatos, amidas, carbonatos, bicarbonatos, hidruros, hidróxidos o alcanolatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como, por ejemplo, acetato de sodio, de potasio o de calcio, amida de litio, de sodio, de potasio o de calcio, carbonato de sodio, de potasio o de calcio, bicarbonato de sodio, de potasio o de calcio, hidruro de litio, de sodio, de potasio o de calcio, hidróxido de litio, de sodio, de potasio o de calcio, metanolato, etanolato, n- o i-propanolato, n-, i-, s- o t-butanolato de sodio o de potasio, además también compuestos nitrogenados básicos tales como, por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, dicitclohexilamina, etil-dicitclohexilamina, N,N-dimetil-anilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetil-piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilamino-piridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]-octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]-non-5-eno (DBN), o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-undec-7-eno (DBU).

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C, preferentemente entre 10°C y 120°C.

El procedimiento según la invención se lleva a cabo, en general, bajo

presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo el procedimiento según la invención bajo presión mas elevada o a presión mas reducida -en general comprendida entre 0,1 bar y 10 bares-.

Para la realización del procedimiento según la invención se emplean los productos de partida, en general, en cantidades aproximadamente equimolares. No obstante es posible también emplear uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se lleva a cabo, en general, en un diluyente adecuado, en presencia de un agente auxiliar de la reacción y la mezcla de la reacción se agita, en general, durante varias horas a la temperatura necesaria. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales (véanse los ejemplos de obtención).

Los productos activos según la invención se pueden emplear como defoliantes, desecantes, agentes herbicidas y especialmente como agentes para eliminar las malas hierbas. Por malas hierbas, en el más amplio sentido, se han de entender las plantas que crecen en lugares donde son indeseadas. El hecho de que las sustancias, según la invención, actúen como herbicidas totales o selectivos, depende esencialmente de la cantidad empleada

Los productos activos según la invención pueden emplearse por ejemplo en las plantas siguientes:

Malas hierbas dicotiledóneas de las clases: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Sencio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum,

Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Cultivos dicotiledóneos de las clases: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Malas hierbas monocotiledóneas de las clases: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Cultivos monocotiledóneos de las clases: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

El empleo de los productos activos según la invención, no está sin embargo, limitado en forma alguna estas clases, sino que se extienden en igual forma también sobre otras plantas.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres descadas y no descadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las

plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces. pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimiento con una o varias capas.

Los productos activos según la invención son adecuados, en función de la concentración, para combatir totalmente las hierbas malas, por ejemplo, en instalaciones industriales y viarias y en caminos y plazas, con y sin crecimiento de árboles. Del mismo modo, se pueden emplear los compuestos para combatir las hierbas malas en cultivos permanentes, por ejemplo, en instalaciones forestales, de árboles de adorno, de árboles frutales, de viñedos, de árboles cítricos, de nogales, de plátanos, de café, de té, de goma de palmas de aceite, de cacao, de frutos de bayas y de lúpulo, sobre trazados ornamentales y deportivos y en superficies de prados y para combatir las hierbas malas en forma selectiva en los cultivos mono- anuales.

Los compuestos según la invención de la fórmula (I) muestran una potente actividad herbicida y un amplio espectro de actividad sobre el terreno y sobre las partes aéreas de las plantas. Son adecuados en cierta medida también para combatir de manera selectiva las malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en cultivos monocotiledóneos y dicotiledóneos, tanto en el procedimiento de pre-brote como en el procedimiento de post-brote.

Los productos activos se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos pulverizables, suspensiones, polvos, medios de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como micro-encapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo, mediante mezcla de los productos activos con materiales extendedores, esto es, con disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado, empleando agentes tensioactivos, esto es, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

En el caso de emplear agua como material de carga se puede emplear, por ejemplo, también disolventes orgánicos como agentes disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran especialmente en consideración: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobenzenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o las parafinas, por ejemplo, las fracciones de petróleo crudo, los aceites minerales y vegetales, los alcoholes tales como butanol, o glicol, así como sus ésteres y éteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona, o ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales molturados, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales sintéticos molturados, tales como ácido silícico, altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por

ejemplo, minerales naturales quebrados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de materiales orgánicos, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo, los emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilenados de ácidos grasos, éteres polioxietilenados de alcoholes grasos, tales como por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, lixiviaciones sulfíticas de lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden emplear adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de latex, tales como goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden emplear colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul ferrocianico y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y de ftalocianina metálicos y nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, por lo general, entre un 0,1 hasta un 95 % en peso de producto activo, preferentemente entre un 0,5 y un 90 %.

Los productos activos según la invención pueden encontrar aplicación como tales o en sus formulaciones también en mezcla con herbicidas conocidos para la lucha contra las malas hierbas, siendo posibles preparados listos para su empleo o mezclas

de tanque.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo:

Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodio), Ametryne, Anidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodio), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop(-propargilo), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron (-metilo), Cloransulam(-metilo), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallylate, Dicamba, Diclofop(-metilo), Diclosulam, Diethatyl(-etilo), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-metilo), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-etilo), Fentrazamide, Flamprop(-isopropilo), Flamprop(-isopropilo-L), Flamprop(-metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-etilo), Flupoxam, Flupropacil, Flupyrasulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone, Fluroxypyr(-mceptyl), Flurprimidol, Flurtantone, Fluthiacet(-metilo), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-amonio), Glyphosate(-isopropilamonio), Halosafen,

Haloxifop(-etoxietilo), Haloxifop(-P-metilo), Hexazinone, Imazamethabenz(-metilo), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron(-metilo, -sodio), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alfa-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-metilo), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, ácido pelargónico, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-metilo), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-etilo), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-metilo), Pyriithiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo), Quizalofop(-P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-metilo), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin y Triflusulfuron.

También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematicidas, sustancias protectoras contra la ingestión por pájaros, sustancias nutrientes de las plantas y medios mejoradores de la estructura del terreno.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de sus

formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de los mismos mediante diluciones ulteriores, tales como soluciones listas para su empleo, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y granulados. El empleo se lleva a cabo en forma usual por ejemplo mediante riego, pulverización, aspersión, esparcido.

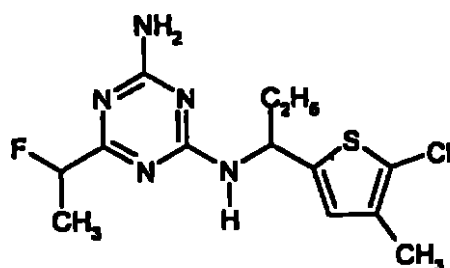
Los productos activos según la invención pueden aplicarse tanto antes como después del brote de las plantas. También pueden incorporarse, en el suelo antes de la siembra.

La cantidad de producto activo empleada puede oscilar dentro de un amplio margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. En general las cantidades empleadas se sitúa entre 1 g y 10 kg de producto activo por hectárea de superficie del terreno, preferentemente entre 5 g y 5 kg por hectárea.

La obtención y el empleo de las sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención:

Ejemplo 1.



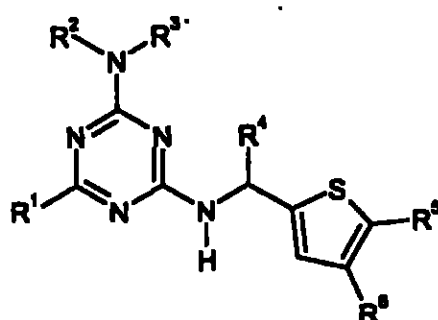
Se agitan durante 18 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) una mezcla constituida por 1,1 g (20 mmoles) de metilato de sodio, 6,2 g (20 mmoles) de 1-[1-(5-cloro-4-metil-tien-2-il)-propil]-biguanida, 2,4 g (20 mmoles) de 2-flúor-propanoato de metilo y 30 ml de metanol. A continuación se diluye con cloruro de metileno (aproximadamente 1:1 en volumen) hasta un volumen aproximadamente

cinco veces mayor y se sacude perfectamente. La fase orgánica se separa, se seca con sulfato de sodio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente por destilación del filtrado bajo presión reducida.

Se obtienen 1,5 g (23 % de la teoría) de la 6-(1-flúor-etil)-N²-[1-(5-cloro-4-metil-2-tienil)-propil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina en forma de residuo amorfo.

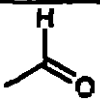
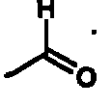
logP (a pH = 2,3): 2,47.

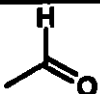
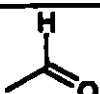
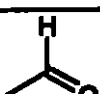
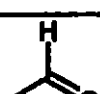
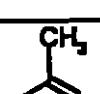
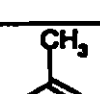
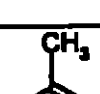
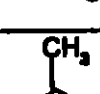
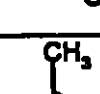
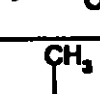
De manera análoga a la del ejemplo 1 así como de acuerdo con la descripción general del procedimiento de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla 1 siguiente.



(I)

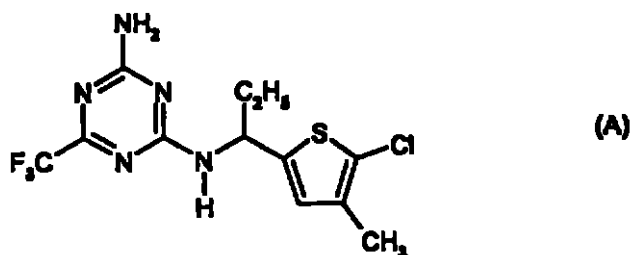
Tabla I: Ejemplo para los compuestos de la fórmula I.

Ej. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Datos físicos
2	C ₂ H ₅	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 1,92 ^{a)}
3	CF(CH ₃) ₂	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 2,49 ^{a)}
4	CHCl ₂	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 3,56 ^{a)}
5	CHF ₂	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 3,04 ^{a)}
6	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Fp.: 58°C
7	CHFCH ₃	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Fp.: 64°C
8	CF(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Fp.: 52°C
9	C ₂ H ₅	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
10	CHFCH ₃	H		CH ₃	Cl	CH ₃	

Ej. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Datos físicos
11	CF(CH ₃) ₂	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
12	C ₂ H ₅	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
13	CHFCH ₃	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
14	CF(CH ₃) ₂	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
15	C ₂ H ₅	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
16	CHFCH ₃	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
17	CF(CH ₃) ₂	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
18	C ₂ H ₅	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
19	CHFCH ₃	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
20	CF(CH ₃) ₂	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	

Ejemplos de aplicación:

En algunos de los ejemplos de aplicación siguientes se utiliza como substancia comparativa el compuesto conocido siguiente:



N²-[1-(5-cloro-4-metil-2-tienil)-propil]-6-trifluormetil-1,3,5-tiazin-2,4-diamina
(conocido por la JP-A-63222166)

Ejemplo A.

Ensayo pre-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se siembran en terreno normal semillas de las plantas de ensayo. Al cabo de 24 horas, aproximadamente, se pulveriza el suelo con la preparación del producto activo de tal manera que se aplique, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada por unidad de superficie. La concentración del caldo de pulverización se elegirá de tal modo que se aplique en 1.000 litros de agua por hectárea, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo del control no tratados.

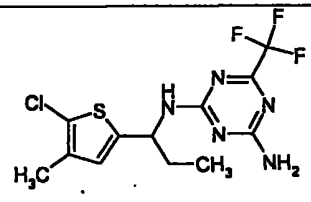
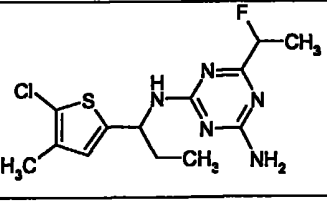
Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles no tratados).

100 % = destrucción total.

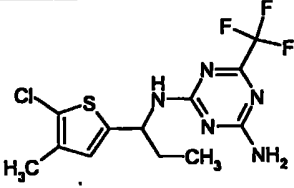
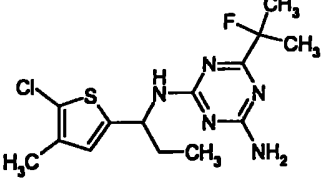
En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 3, y 5, parcialmente con una buena compatibilidad para con las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, maíz, un efecto notablemente mas potente contra las malas hierbas que el del compuesto conocido (A).

Tabla A1: Ensayo de pre-brote/invernadero

Producto activo	Cantidad apli- cada (g ai./ha)	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Ipomoea
					
(A)	500	0	0	-	0
					
(I)	500	100	95	100	100

27

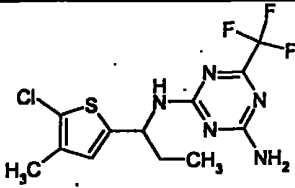
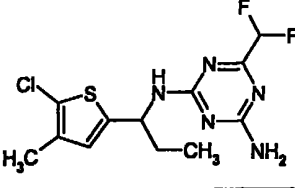
Tabla A2: Ensayo de pre-brote/invernadero

Producto activo	Cantidad apli- cada (g ai./ha)	Maíz	Setaria	Amaranthus	Galium	Sinapis
						
(A)	500	0	0	-	0	0
						
(3)	500	0	80	100	80	95

-25-

24

Tabla A3: Ensayo de pre-brote/invernadero

Producto activo	Cantidad apli- cada (g ai./ha)	Maíz	Alopecurus	Setaria	Amaranthus	Galium
						
(A)	500	0	0	0	-	0
						
(S)	500	0	80	80	100	80

Ejemplo B.

Ensayo de post-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se pulverizan, con la preparación del producto activo, plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm, de tal manera que, se apliquen respectivamente las cantidades de producto activo deseadas por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elige de tal forma que se aplique en 1.000 litros de agua/ha la cantidad deseada en cada caso de producto activo.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo de los controles sin tratar.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 3, 4 y 5, parcialmente con una buena compatibilidad parcialmente frente a las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, maíz, un potente efecto contra las malas hierbas.

Tabla B1: Ensayo de post-brote/invernadero

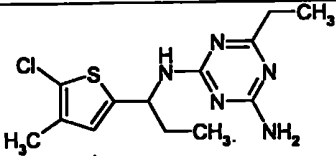
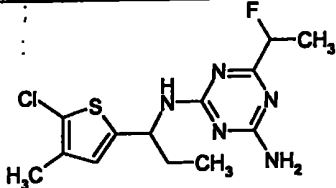
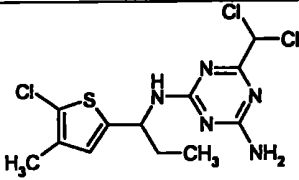
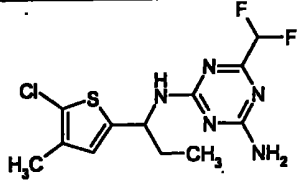
Producto activo	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Ipomoea	Sinapis
						
(2)	500	100	100	100	100	100
						
(1)	500	100	100	100	100	100

Tabla B1: Ensayo de post-brote/invernadero (continuación)

Producto activo	Cantidad apli- cada (g ai./ha)	Setaria	Abutilon	Amaranthus	Ipomoea	Sinapis
						
(4)	500	90	100	100	100	100
						
(5)	500	100	100	100	100	100

29

Tabla B2: Ensayo de post-brote/invernadero

Producto activo	Cantidad apli- cada (g ai./ha)	Alope- curus	Echino- chloa	Abutilon	Ama- ranthus	Ipomoea	Sinapis
<chem>CN1C=NC2=C(N1)C(=CNC2C3=CC=C(C=C3)S4=CC=C(C=C4)Cl)C5</chem> (3)	500	95	95	100	100	100	100

Tabla B3: Ensayo de post-brote/invernadero

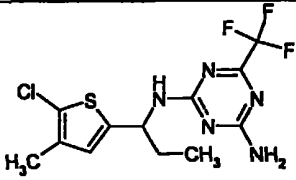
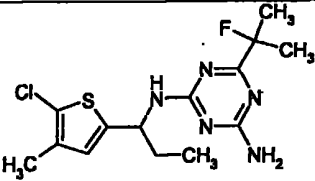
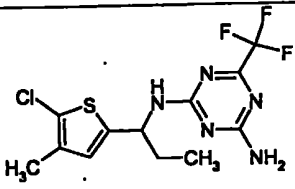
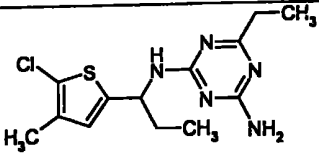
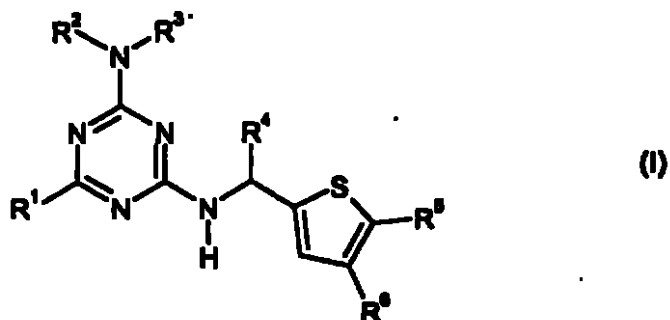
Producto activo	Cantidad apli- cada (g ai./ha)	Alopecurus	Echinochloa
			
(A)	500	80	60
			
(3)	500	95	95

Tabla B4: Ensayo de post-brote/invernadero

Producto activo	Cantidad aplicada (g ai./ha)	Matz	Setaria	Amaranthus	Galium
					
(A)	500	0	0	-	0
					
(2)	500	0	80	100	100

REIVINDICACIONES

1.- Compuestos de la fórmula general (I)



en la que

- R¹ significa dihalógenometilo, etilo, halógenoetilo, dihalógenoetilo, n-propilo, halógeno-n-propilo, dihalógeno-n-propilo, i-propilo, halógeno-i-propilo, dihalógeno-i-propilo, halógenociclopropilo, dihalógenociclopropilo o trihalógenociclopropilo,
- R² significa hidrógeno o significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R³ significa hidrógeno, significa formilo o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirole, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R⁵ significa cloro o metilo y

R⁶ significa cloro o metilo,

estando dispuestos los sustituyentes sobre el átomo de carbono, con el cual está enlazado R⁴, fundamentalmente bien en configuración R o en configuración S, así como también los racematos correspondientes.

2.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

R¹ significa difluórmethyl, diclorometilo, dibromometilo, clorofluórmethyl, clorobromometilo, flúorbromometilo, etilo, flúoretilo, cloroetilo, bromoetilo, difluoretilo, dicloroetilo, dibromoetilo, clorofluoretilo, bromofluoretilo, n-propilo, flúor-n-propilo, cloro-n-propilo, bromo-n-propilo, difluor-n-propilo, dicloro-n-propilo, i-propilo, flúor-i-propilo, cloro-i-propilo, bromo-i-propilo, difluor-i-propilo, dicloro-i-propilo, flúorciclopropilo, clorociclopropilo, difluorciclopropilo, diclorociclopropilo, difluorciclopropilo, triclorociclopropilo, clorodifluorciclopropilo o flúordiclorociclopropilo,

R² significa hidrógeno o significa metilo o etilo substituidos en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R³ significa hidrógeno, significa formilo o significa metilo, etilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R⁵ significa cloro o metilo y

R⁶ significa cloro o metilo.

3.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

- R¹** significa difluórmétilo, diclorométilo, dibromométilo, clorofluórmétilo, etilo, 1-flúor-etilo, 2-flúor-etilo, 1-cloro-etilo, 2-cloro-etilo, 1-bromo-etilo, 2-bromo-etilo, 1,1-difluóor-etilo, 1,2-difluóor-etilo, 2,2-difluóor-etilo, 1,1-dicloro-etilo, 1,2-dicloro-etilo, 2,2-dicloro-etilo, 1,2-dibromo-etilo, 1-cloro-1-flúoretilo, 1-cloro-2-flúor-etilo, 2-cloro-1-flúor-etilo, 2-cloro-2-flúor-etilo, 1-flúor-n-propilo, 2-flúor-n-propilo, 1-cloro-n-propilo, 2-cloro-n-propilo, 1-bromo-n-propilo, 2-bromo-n-propilo, 1-flúor-i-propilo, 1-cloro-i-propilo, difluóorciclopropilo o diclorociclopropilo,
- R²** significa hidrógeno, metilo o etilo,
- R³** significa hidrógeno, significa formilo, significa metilo o etilo, o significa acetilo, propionilo, n- o i-butirole, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,
- R⁴** significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,
- R⁵** significa cloro o metilo y
- R⁶** significa cloro o metilo.

4.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

- R¹** significa difluórmétilo, diclorométilo, clorofluórmétilo, etilo, 1-flúor-etilo, 1-cloro-etilo, 1,1-difluóor-etilo, 1,2-difluóor-etilo, 1,1-dicloroetilo, 1,2-dicloroetilo, 1-cloro-1-flúoretilo, 1-cloro-2-flúor-etilo, 2-cloro-1-flúor-etilo, 1-flúor-n-propilo, 1-cloro-n-propilo, 1-flúor-i-propilo o 1-cloro-i-propilo,
- R²** significa hidrógeno,

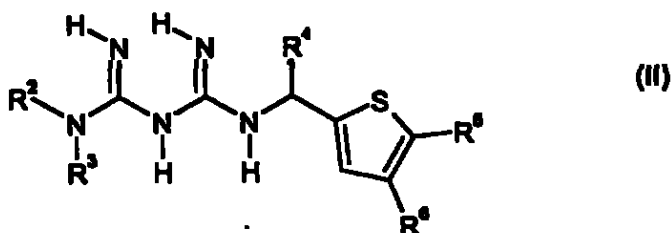
R^3 significa hidrógeno, significa formilo o significa acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro,

R^5 significa cloro y

R^6 significa metilo.

5.- Procedimiento para la obtención de compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque se hacen reaccionar compuestos de la fórmula general (II)

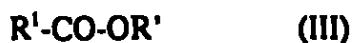


en la que

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 tienen los significados indicados en una de las reivindicaciones 1 a 4,

-y/o aductos con ácidos de los compuestos de la fórmula general (II)-

con compuestos de alcóxicarbonilo de la fórmula general (III)



en la que

R^1 tiene el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4 y

R' significa alquilo,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

y, en caso dado se llevan a cabo en los compuestos, obtenidos de este modo, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los sustituyentes, otras transformaciones según métodos usuales.

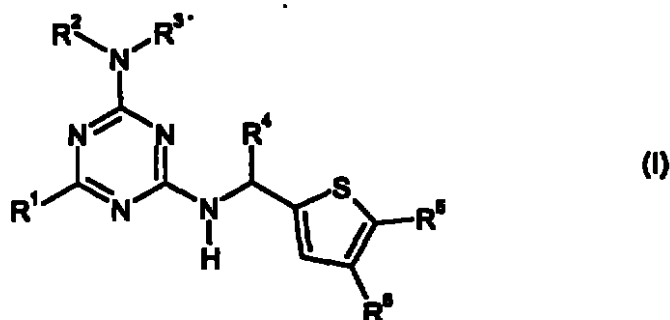
6.- Procedimiento para la lucha contra el crecimiento indeseable de las plantas, caracterizado porque se deja actuar sobre las plantas indeseables y/o sobre su medio ambiente al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4.

7.- Empleo de al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4, para la lucha contra las plantas indeseables.

8.- Agente herbicida, caracterizado porque tiene un contenido en un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4, y extendedores y/o agentes tensioactivos usuales.

RESUMEN

La presente invención se refiere a nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I),



en la que

R¹, R², R³, R⁴, tienen el significado indicado en la descripción,

R⁵ significa cloro o metilo y

R⁶ significa cloro o metilo,

estando dispuestos los substituyentes en el átomo de carbono, con el cual está enlazado R⁴, fundamentalmente bien en configuración R o en configuración S. La invención se refiere también a los racematos correspondientes así como a un procedimiento para la obtención de todos los compuestos según la invención y a su empleo como herbicidas.

39 0698
6028

CONSULADO DE COLOMBIA

CERTIFICACION

No. 145

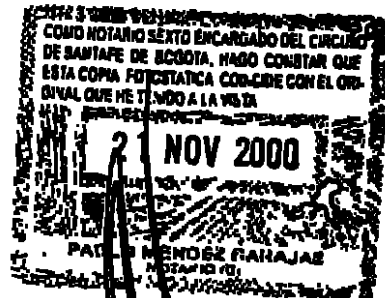
Bonn, 8 de agosto de 1996

El suscrito Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares de Colombia en Bonn, vistos los documentos presentados por los interesados, CERTIFICA: Que el señor Dirk Heiderhoff quien como Notario en Leverkusen autentico la firma de los signatarios DR. ROLF BRAUN y DR. JOACHIM GREMM del documento precedente, ejercian en la fecha las funciones indicadas y su firma corresponde a la registrada en este Consulado; que la empresa BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT esta constituida de acuerdo con las leyes de la Republica Federal de Alemania y cumple su objeto conforme a las mismas segun el Registro Comercial HRB 1122 del Tribunal de Primera Instancia de Leverkusen; que los señores BRAUN y GREMM, quienes firmaron el documento precedente, son los representantes legales de la empresa arriba mencionada.

El suscrito Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento.

Pagado el impuesto de timbre
y derechos consulares.
Valor US\$106,00 = DM\$169,60

JUAN PABLO GONZALEZ
Segundo Secretario
Encargado de las Funciones Consulares



DETE COTEJACIONES
SANTA FE DE BOGOTA N.T.
1996 AGO 23 A 11:58
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
NO SE ASUME

LA FIRMAS ALMUELA
DOCUMENTO DESMPEHA
LAS FUNCIONES INDICADA
1996 AGO 23
EXPIRACION

Dirk Heiderhoff

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4ª N° 72-35

BOGOTÁ - COLOMBIA

For patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTATION AND
POWER OF ATTORNEY

REPRESENTACION Y PODER

I (we), the undersigned/Yo (nosotros), abajo firmado (s)

BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT

of/domiciliado (s) en D-51368 Leverkusen,
GERMANY,

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistír, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

In due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact of its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, consumer protection, oppositions or observations, administrative and judicial cancellation, nullity, infringement, protective measures, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and processes that we promote or are promoted against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, renounce, and ratify the acts done by representative with or without agents of office.

Given and signed this/Dado y firmado hoy

31st July 1996

In/en Leverkusen

BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT

Signature

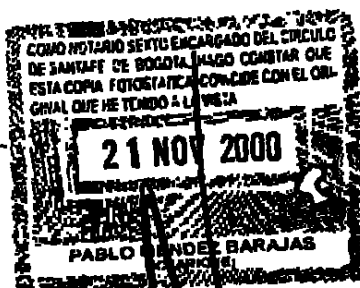
Firma

LEGALIZACION

El Señor Cónsul de Colombia debe expedir un certificado consular sobre (1) la existencia legal de la compañía que otorga el poder, (2) que ésta ejerce su objeto social, y (3) que las personas que otorgan el poder están autorizadas para dárselo. A este efecto les solicitamos que muestren al Señor Cónsul las pruebas que acreditan esos hechos (1), (2) y (3).

LEGALIZATION

The Colombia Consul must issue a consular certificate, the legal existence of the company which is a Power-of-Attorney, (2) that it is in actual exercise of company purposes, and (3) that the persons who are Power of Attorney is authorized to do so. To this effect show the Consul the evidence to prove the above facts and (3).



NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL DE COLOMBIA: Según los artículos 65 del C. de P.C. y 480 del C. de Co., si el poderdante es una sociedad, el Señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia, que ejerce su objeto social y que quien confiere el poder es su representante.

41
JRNr 1799/1996

Ich beglaubige die vor mir vollzogenen Unterschriften der Herren

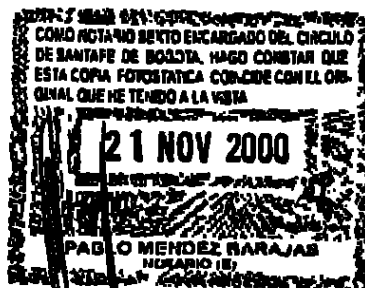
1. Dr. Wolf Braun, geschäftsansässig in D 51368
Leverkusen, Bayerwerk,
2. Dr. Joachim Gremm, geschäftsansässig in D 51368
Leverkusen, Bayerwerk,

- persönlich bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund Einsicht vom heutigen Tage in das Handelsregister des Amtsgerichts Leverkusen - HRB 1122 -, daß die genannten Herren berechtigt sind, die Bayer Aktiengesellschaft in Leverkusen als Prokuristen gemeinschaftlich zu vertreten.

Leverkusen, den 31. Juli 1996

H. Linn
Notar



Die Echtheit der vorstehenden Unterschriften des Notars *Dr. J. Gremm* in Leverkusen sowie die Echtheit des beigefügten Dienstwappels - siegels werden hiermit bestätigt. Zugleich wird bescheinigt, daß der Notar zur Vornahme der Amtshandlung befugt war.

Köln, den 2. Aug. 1996

Der Präsident des Landgerichts

R. Wöhrling
(Dr. Wöhrling)





COMO NOTARIO SEXTO ENCARGADO DEL CIRCUITO
DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE
ESTA COPIA FOTOSTATICA CONCORDA CON EL ORI-
GINAL QUE HE VISTO A LA VISTA

21 NOV 2000

PAULO INFIEROZ SANTAFAN

TRADUCCION OFICIAL No. 5424

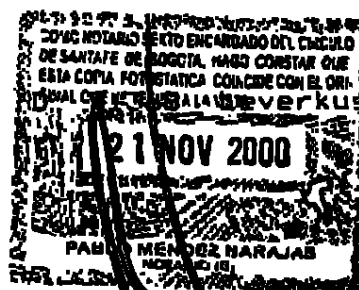
de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente.-

(A continuación de la representación y poder conferido a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO tpa, 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia, el 31 de julio de 1996 por los señores Dr. Rolf Braun y Dr. Joachim Gremm, apoderados de la Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen, RFA:)

Protocolo notarial 1799/1996

Certifico la autenticidad de las firmas puestas ante mi por los señores

1. Dr. Rolf Braun, domiciliado en D 91368 Leverkusen, Bayerwerk,
 2. Dr. Joachim Gremm, domiciliado en Bayerwerk,
- a quienes conozco en persona.-



Certifico por haber tenido a la vista el Registro de Comercio del Juzgado Municipal de Leverkusen - HRB 1122 - que los señores mencionados están facultados, en su calidad de apoderados, para representar conjuntamente a la Bayer Aktiengesellschaft, domiciliada en Leverkusen.

Leverkusen, 31 de julio de 1996

Fdo.: firma ilegible

Notario

(Hilo y oblea notarial en relieve:)

Dirke Heiderhoff - Notario de Leverkusen

(dorso:)

Se certifica la autenticidad de la firma antecedente del notario de Leverkusen, Dirke Heiderhoff, y la del sello oficial que la acompaña. Igualmente se certifica que el mencionado notario estaba facultado para realizar ese acto oficial.

Colonia, 02 de agosto de 1996

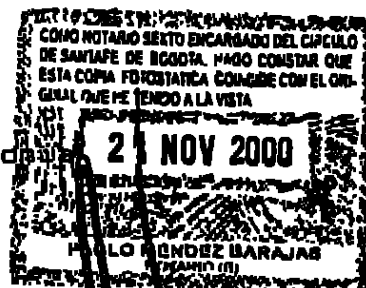
El Presidente del Juzgado Municipal

Fdo.: firma ilegible

(Dr. Wohlmich)

(sello redondo en tinata:)

El Presidente del Juzgado Municipal de Colonia



EN ESPAÑOL: La legalización de las firmas antecedentes por el Consulado de Colombia en Bonn bajo el No. 145 del 08 de agosto de 1996 y por el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia bajo el No. 198692 del 23 de agosto de 1996.

Pagados Impuesto de timbre y derechos consulares US\$ 106,--

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en los archivos de estas oficinas para su confrontación.

Santafé de Bogotá, 2 de septiembre de 1996

COMO NOTARIO SEXTO DE SNTAFE DE BOGOTA
HAGO CONSTAR QUE LA FIRMA DE

[Firma manuscrita]
C.C. *[Firma manuscrita]*
COINCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (ELLOS)
EN ESTA NOTARIA.

9 SET. 1996
SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

DEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

9 SET 1996

RESPONSABILIDAD
NO SE ASUME

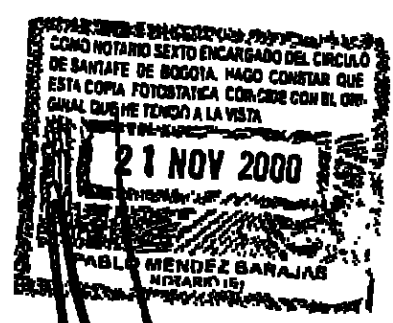


DE LEGALIZACIONES
CURIA A LA ADELTA
BOGOTA DE BOGOTA

205398
29 SET 1996

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

[Firma manuscrita]



CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO BISKI

CARRERA 41, No. 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

TELEFAX: (57) 111 2358880
CABLES CAVELEYES
TELEX: 45478

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE
TELEFONO: (57) 111 2120100

Señor Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Poderdante: **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT**

Poder conferido el: 31-07-96

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder que me ha sido conferido en la persona del doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No. 31.929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,



GERMAN CAVELIER

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

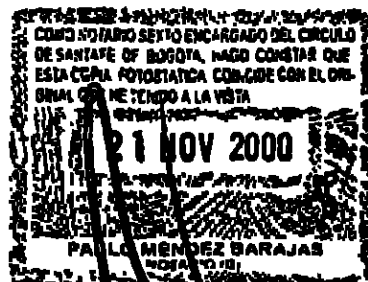
Acepto:



EMILIO FERRERO

T.P.A. No 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén



NOTARIA SEXTA DE BOGOTÁ
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL

Santafé de Bogotá D. C.

08 SET 1996

Ante M^{te} JUAN MANUEL GÓTERO RIVERA

NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTÁ

Compareció(eron) personalmente,

[Firma]

[Firma]

quien(es) exhibió(aron) L. (s) C.

478019

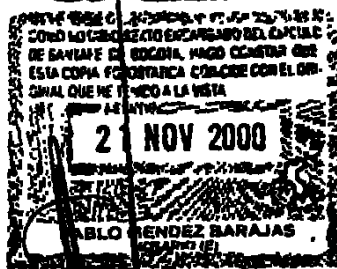
y la(s) Libreta(s) de Identificación

2877924

77852 7787929

domiciliado en Bogotá, D. C., y que (a) (s) firma(s) que
aparece(n) en el presente documento, que (a) (s) su(s) su(s), y que
el contenido de este documento es verdadero y
En constancia en fe de esta diligencia.

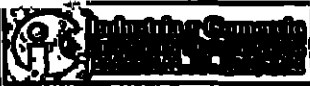
[Firma]



Folios 46 y 47
anexos



retirado folio 48 -
extracto. 2002-08-02
202043



FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Sede: Calle 100 No. 100-100

Expediente No		No de Folio
Item	No de unidades	
1	CD	
2	DVD	
3	REVISTA	
4	LIBRO	
5	PERIODICO	
6	DISQUETES	
7	SOBRE DE MANILA	1
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO	
10	OTROS:	

Observaciones: A la Fin



**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung**



Aktenzeichen: 198 82 931.5 ✓
Anmeldetag: 24. Dezember 1999 /
Anmelder/inhaber: Bayer Aktiengesellschaft,
Leverkusen/DE
Bezeichnung: Substituierte Thienylalkylamino-1,3,5-triazine
IPC: C 07 D, A 01 N

**Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ur-
sprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.**



München, den 21. September 2000
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag

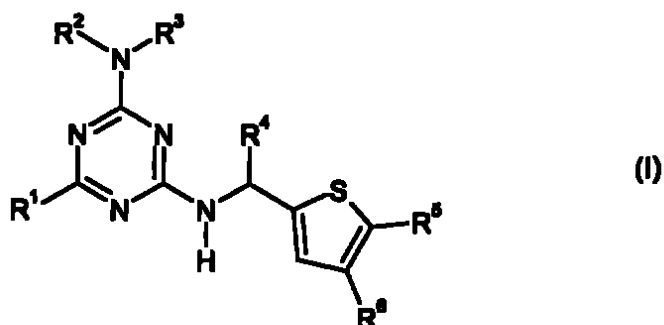
Nietiedt

Substituierte Thienylalkylamino-1,3,5-triazine

Die Erfindung betrifft neue substituierte Thienylalkylamino-1,3,5-triazine, Verfahren
zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Eine Reihe von Thienylalkylamino-1,3,5-triazinen ist bereits aus der (Patent)-
Literatur bekannt (vgl. JP-A-63222166 - zitiert in Chem. Abstracts 111:97288w,
WO-A-98/15537, WO-A-98/15538, WO-A-98/15539, WO-A-99/18100). Diese Ver-
bindungen haben jedoch bisher keine besondere Bedeutung erlangt.

Es wurden nun die neuen substituierten Thienylalkylamino-1,3,5-triazine der allge-
meinen Formel (I)



in welcher

R¹ für Dihalogenmethyl, Ethyl, Halogenethyl, Dihalogenethyl, n-Propyl,
Halogen-n-propyl, Dihalogen-n-propyl, i-Propyl, Halogen-i-propyl, Di-
halogen-i-propyl, Halogencyclopropyl, Dihalogencyclopropyl oder Tri-
halogencyclopropyl steht,

R² für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen,
Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-
Propyl steht,

R³ für Wasserstoff, für Formyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl steht,

R⁴ für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht,

R⁵ für Chlor oder Methyl steht und

R⁶ für Chlor oder Methyl steht,

wobei die Substituenten an dem Kohlenstoffatom, an welches **R⁴** gebunden ist, im wesentlichen entweder in R-Konfiguration oder in S-Konfiguration angeordnet sind, sowie auch die jeweiligen Racemate gefunden.

Sofern **R¹** für einen Substituenten mit einem asymmetrisch substituierten Kohlenstoffatom steht, sind sowohl die jeweils möglichen Diastereomerengemische als auch die einzelnen möglichen Diastereomeren Gegenstand der Erfindung.

Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend aufgeführten Formeln vorhandenen Reste werden im Folgenden beschrieben.

R¹ steht bevorzugt für Difluormethyl, Dichlormethyl, Dibrommethyl, Chlorfluormethyl, Chlorbrommethyl, Fluorbrommethyl, Ethyl, Fluorethyl, Chlorethyl, Bromethyl, Difluorethyl, Dichlorethyl, Dibromethyl, Chlorfluorethyl, Bromfluorethyl, n-Propyl, Fluor-n-propyl, Chlor-n-propyl, Brom-n-propyl, Difluor-n-propyl, Dichlor-n-propyl, i-Propyl, Fluor-i-propyl, Chlor-i-propyl, Brom-i-propyl, Difluor-i-propyl, Dichlor-i-propyl, Fluorcyclopropyl, Chlorcyclo-

- 3 -

propyl, Difluorcyclopropyl, Dichlorcyclopropyl, Trifluorcyclopropyl, Trichlorcyclopropyl, Chlordifluorcyclopropyl oder Fluordichlorcyclopropyl.

5 R^2 steht bevorzugt für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl oder Ethyl.

10 R^3 steht bevorzugt für Wasserstoff, für Formyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl.

15 R^4 steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl.

R^5 steht bevorzugt für Chlor oder Methyl.

R^6 steht bevorzugt für Chlor oder Methyl.

20 R^1 steht besonders bevorzugt für Difluormethyl, Dichlormethyl, Dibrommethyl, Chlorfluormethyl, Ethyl, 1-Fluor-ethyl, 2-Fluor-ethyl, 1-Chlor-ethyl, 2-Chlor-ethyl, 1-Brom-ethyl, 2-Brom-ethyl, 1,1-Difluor-ethyl, 1,2-Difluor-ethyl, 2,2-Difluor-ethyl, 1,1-Dichlor-ethyl, 1,2-Dichlor-ethyl, 2,2-Dichlor-ethyl, 1,2-Dibrom-ethyl, 1-Chlor-1-fluorethyl, 1-Chlor-2-fluor-ethyl, 2-Chlor-1-fluor-ethyl, 2-Chlor-2-fluor-ethyl, 1-Fluor-n-propyl, 2-Fluor-n-propyl, 1-Chlor-n-propyl, 2-Chlor-n-propyl, 1-Brom-n-propyl, 2-Brom-n-propyl, 1-Fluor-i-propyl, 1-Chlor-i-propyl, Difluorcyclopropyl oder Dichlorcyclopropyl.

25 R^2 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.

30

5 R^3 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für Formyl, für Methyl oder Ethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl.

R^4 steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl.

-10

R^5 steht besonders bevorzugt für Chlor oder Methyl.

R^6 steht besonders bevorzugt für Chlor oder Methyl.

15

R^1 steht ganz besonders bevorzugt für Difluormethyl, Dichlormethyl, Chlorfluormethyl, Ethyl, 1-Fluor-ethyl, 1-Chlor-ethyl, 1,1-Difluor-ethyl, 1,2-Difluor-ethyl, 1,1-Dichlor-ethyl, 1,2-Dichlor-ethyl, 1-Chlor-1-fluorethyl, 1-Chlor-2-fluor-ethyl, 2-Chlor-1-fluor-ethyl, 1-Fluor-n-propyl, 1-Chlor-n-propyl, 1-Fluor-i-propyl oder 1-Chlor-i-propyl.

20

R^2 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.

-10

R^3 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für Formyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl.

25

R^4 steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl.

30

R^5 steht ganz besonders bevorzugt für Chlor.

R^6 steht besonders bevorzugt für Methyl.

5 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

10

Erfindungsgemäß bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

15

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

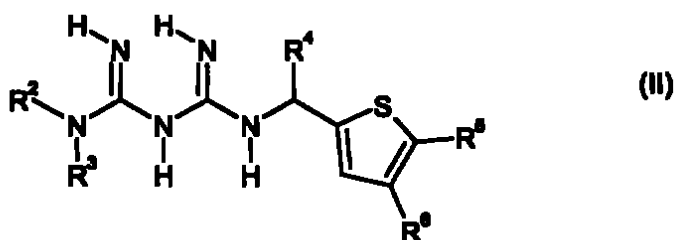
20



Die neuen substituierten Thienylalkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I) weisen interessante biologische Eigenschaften auf. Sie zeichnen sich insbesondere durch starke herbizide Wirksamkeit aus.

25

Man erhält die substituierten Thienylalkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I), wenn man Biguanide der allgemeinen Formel (II)



- 6 -

in welcher

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und R^6 die oben angegebene Bedeutung haben,

5 - und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) -

mit Alkoxycarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (III)



10

in welcher

R^1 die oben angegebene Bedeutung hat und

15 R' für Alkyl steht,

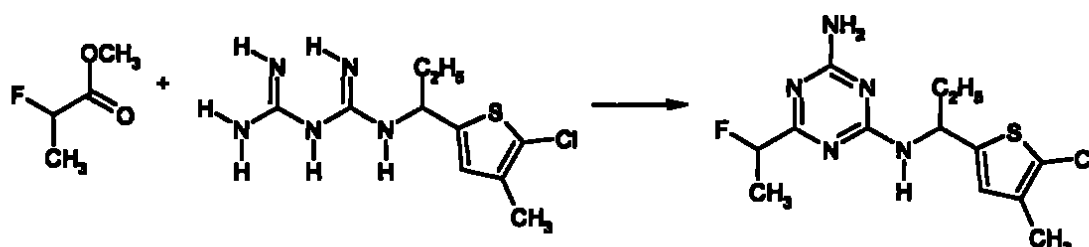
gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

20

und gegebenenfalls an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition weitere Umwandlungen nach üblichen Methoden durchführt.

Verwendet man beispielsweise 1-(5-Chlor-4-methyl-thien-2-yl-propyl)-biguanid und 2-Fluor-propansäure-methylester als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren durch das folgende Formelschema skizziert werden:

25



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Biguanide sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (II) haben R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und R^6 vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und R^6 angegeben worden sind.

Geeignete Säureaddukte von Verbindungen der Formel (II) sind deren Additionsprodukte mit Protonensäuren, wie z.B. mit Chlorwasserstoff (Hydrogenchlorid), Bromwasserstoff (Hydrogenbromid), Schwefelsäure, Methansulfonsäure, Benzolsulfonsäure und p-Toluolsulfonsäure.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. JP-A-63222166, WO-A-99/18100).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Alkoxycarbonylverbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (III) hat R^4 vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für R^3 angegeben worden ist; R^4 steht vorzugsweise für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere für Methyl oder Ethyl.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind bekannte Syntheschemikalien.

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) wird vorzugsweise unter Verwendung eines Verdünnungsmittels durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens kommen neben Wasser vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Als Reaktionshilfsmittel für das erfindungsgemäße Verfahren kommen im allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonat, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-amid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium- -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propanolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin,

5 Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8 Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU).

10 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

15 Das erfindungsgemäße Verfahren wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, das erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

20 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Auf-
25 arbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliantes, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden.
30 Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten auf-

wachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

5

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

10

15

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

20

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

25

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

5 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden durch durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungs-
10 material, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.
15

20 Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungs-
material, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.
25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Zierge-
30 hölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-,

Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

- 5 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

10.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

15

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum-erzeugenden Mitteln.

20

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methyisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

25

30

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum-
erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfit-ablaugen und Methylcellulose.

15

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

20

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

25

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

5 Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodium),
Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin,
Azimsulfuron, Benazolin(-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon,
Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-
sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim,
Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-ethyl), Chlo-
methoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlor-
sulfuron, Chlortoluron, Cinidon(-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim,
Clethodim, Clodinafop(-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyra-
sulfuron(-methyl), Cloransulam(-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne,
Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP,
Desmedipham, Diallylate, Dicamba, Diclofop(-methyl), Diclosulam, Diethatyl(-ethyl),
Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor,
Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Di-
thiopyr, Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulf-
uron(-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop-
(-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop(-isopropyl), Flamprop(-isopropyl-L), Flamprop(-
methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone,
Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumet-
sulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-ethyl), Flupoxam, Fluprop-
acil, Flurpyrsulfuron(-methyl, -sodium), Flurenol(-butyl), Fluridone, Fluroxypyr(-
meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-methyl), Fluthiamide, Fomesafen,
Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop-
(-ethoxyethyl), Haloxyfop(-P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz(-methyl),
Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazo-
sulfuron, Iodosulfuron(-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron,

5 Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendi-methalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primi-sulfuron(-methyl), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-ethyl), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-methyl), Pyri-thiobac(-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-ethyl), Quizalofop(-P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thia-fluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-methyl), Thiobencarb, Tiocarb-azil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-methyl), Triclopyr, Tri-diphane, Trifluralin und Triflursulfuron.

20 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzen-nährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

25 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

30 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden einge-arbeitet werden.

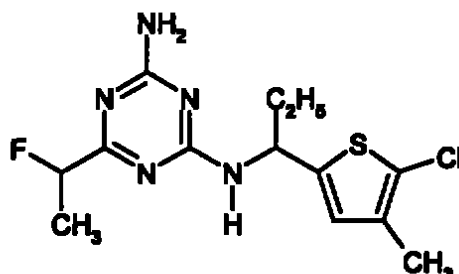
Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

5

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

10



Herstellungsbeispiele:**Beispiel 1**

5

Eine Mischung aus 1,1 g (20 mMol) Natriummethylat, 6,2 g (20 mMol) 1-[1-(5-Chlor-4-methyl-thien-2-yl)-propyl]-biguanid, 2,4 g (20 mMol) 2-Fluor-propansäuremethylester und 30 ml Methanol wird 18 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Anschließend wird mit Methylenchlorid und Wasser (Vol. ca. 1:1) auf etwa das fünffache Volumen verdünnt und gut durchgeschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

10

Man erhält 1,5 g (23% der Theorie) 6-(1-Fluor-ethyl)-N²-[1-(5-chlor-4-methyl-2-thienyl)-propyl]-1,3,5-triazin-2,4-diamin als amorphen Rückstand.

15

logP (bei pH = 2,3): 2,47.

Analog zu Beispiel 1 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

20

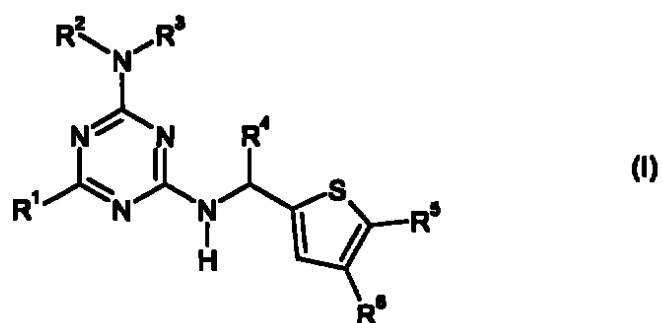
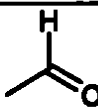
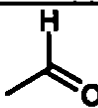
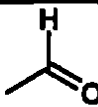
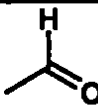
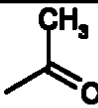
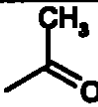
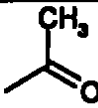
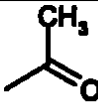
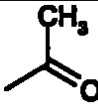
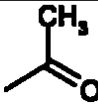


Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

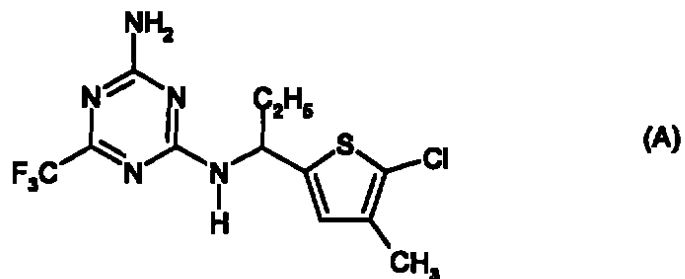
Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
2	C ₂ H ₅	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 1,92 ^{a)}
3	CF(CH ₃) ₂	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 2,49 ^{a)}
4	CHCl ₂	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 3,56 ^{a)}
5	CHF ₂	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 3,04 ^{a)}
6	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Fp.: 58°C
7	CHFCH ₃	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Fp.: 64°C
8	CF(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Fp.: 52°C
9	C ₂ H ₅	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
10	CHFCH ₃	H		CH ₃	Cl	CH ₃	

Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikal. Daten
11	CF(CH ₃) ₂	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
12	C ₂ H ₅	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
13	CHFCH ₃	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
14	CF(CH ₃) ₂	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
15	C ₂ H ₅	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
16	CHFCH ₃	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
17	CF(CH ₃) ₂	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
18	C ₂ H ₅	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
19	CHFCH ₃	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
20	CF(CH ₃) ₂	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	

Anwendungsbeispiele:

Bei einigen der nachfolgenden Anwendungsbeispiele wird die folgende bekannte Verbindung als Vergleichssubstanz herangezogen:

5



N²-[1-(5-Chlor-4-methyl-2-thienyl)-propyl]-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin-2,4-diamin
(bekannt aus JP-A-63222166)

10

Beispiel A**Pre-emergence-Test**

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, dass die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Wirkstoffkonzentration in der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20 Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

25 In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 3 und 5 bei zum Teil guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, erheblich stärkere Wirkung gegen Unkräuter als die bekannte Verbindung (A).

Beispiel B

Post-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, dass die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

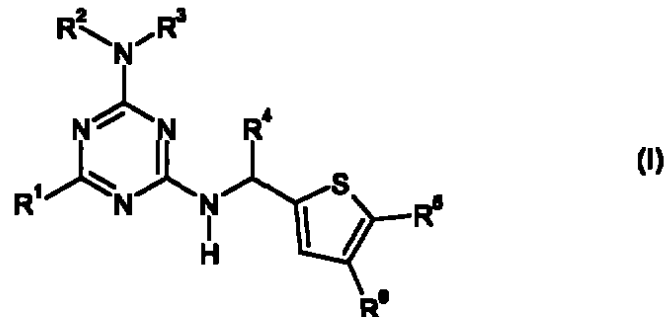
Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

20 Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

25 In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 3, 4 und 5 bei zum Teil guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, starke Wirkung gegen Unkräuter.

Patentansprüche:**1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I)**

in welcher

R¹ für Dihalogenmethyl, Ethyl, Halogenethyl, Dihalogenethyl, n-Propyl, Halogen-n-propyl, Dihalogen-n-propyl, i-Propyl, Halogen-i-propyl, Dihalogen-i-propyl, Halogencyclopropyl, Dihalogencyclopropyl oder Trihalogencyclopropyl steht,

R² für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

R³ für Wasserstoff, für Formyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl steht,

R⁴ für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht,

R^5 für Chlor oder Methyl steht und

R^6 für Chlor oder Methyl steht,

5

wobei die Substituenten an dem Kohlenstoffatom, an welches R^4 gebunden ist, im wesentlichen entweder in R-Konfiguration oder in S-Konfiguration angeordnet sind, sowie auch die jeweiligen Racemate.

10

2. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

15

R^1 für Difluormethyl, Dichlormethyl, Dibrommethyl, Chlorfluormethyl, Chlorbrommethyl, Fluorbrommethyl, Ethyl, Fluorethyl, Chlorethyl, Bromethyl, Difluorethyl, Dichlorethyl, Dibromethyl, Chlorfluorethyl, Bromfluorethyl, n-Propyl, Fluor-n-propyl, Chlor-n-propyl, Brom-n-propyl, Difluor-n-propyl, Dichlor-n-propyl, i-Propyl, Fluor-i-propyl, Chlor-i-propyl, Brom-i-propyl, Difluor-i-propyl, Dichlor-i-propyl, Fluorcyclopropyl, Chlorcyclopropyl, Difluorcyclopropyl, Dichlorcyclopropyl, Trifluorcyclopropyl, Trichlorcyclopropyl, Chlordifluorcyclopropyl oder Fluordichlorcyclopropyl steht,

20

R^2 für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl oder Ethyl steht,

25

R^3 für Wasserstoff, für Formyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl steht,

30

R^4 für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

R^5 für Chlor oder Methyl steht und

R^6 für Chlor oder Methyl steht.

3. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

R^1 für Difluormethyl, Dichlormethyl, Dibrommethyl, Chlorfluormethyl, Ethyl, 1-Fluor-ethyl, 2-Fluor-ethyl, 1-Chlor-ethyl, 2-Chlor-ethyl, 1-Brom-ethyl, 2-Brom-ethyl, 1,1-Difluor-ethyl, 1,2-Difluor-ethyl, 2,2-Difluor-ethyl, 1,1-Dichlor-ethyl, 1,2-Dichlor-ethyl, 2,2-Dichlor-ethyl, 1,2-Dibrom-ethyl, 1-Chlor-1-fluorethyl, 1-Chlor-2-fluor-ethyl, 2-Chlor-1-fluor-ethyl, 2-Chlor-2-fluor-ethyl, 1-Fluor-n-propyl, 2-Fluor-n-propyl, 1-Chlor-n-propyl, 2-Chlor-n-propyl, 1-Brom-n-propyl, 2-Brom-n-propyl, 1-Fluor-i-propyl, 1-Chlor-i-propyl, Difluorcyclopropyl oder Dichlorcyclopropyl steht,

R^2 für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht,

R^3 für Wasserstoff, für Formyl, für Methyl oder Ethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl steht,

R^4 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

R^5 für Chlor oder Methyl steht und

R^6 für Chlor oder Methyl steht.

4. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

R^1 für Difluormethyl, Dichlormethyl, Chlorfluormethyl, Ethyl, 1-Fluor-ethyl, 1-Chlor-ethyl, 1,1-Difluor-ethyl, 1,2-Difluor-ethyl, 1,1-Dichlor-ethyl, 1,2-Dichlor-ethyl, 1-Chlor-1-fluorethyl, 1-Chlor-2-fluor-ethyl, 2-Chlor-1-fluor-ethyl, 1-Fluor-n-propyl, 1-Chlor-n-propyl, 1-Fluor-i-propyl oder 1-Chlor-i-propyl steht,

R^2 für Wasserstoff steht,

R^3 für Wasserstoff, für Formyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl steht,

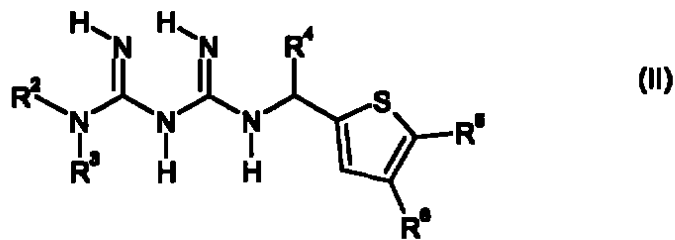
R^4 für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

R^5 für Chlor steht und

R^6 für Methyl steht.

5. Verfahren zum Herstellen der Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass Verbindungen der allgemeinen Formel (II)

- 27 -



in welcher

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und R^6 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

- und/oder Säureaddukte von Verbindungen der allgemeinen Formel (II) -

mit Alkoxycarbonylverbindungen der allgemeinen Formel (III)



in welcher

R^1 die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung hat und

R' für Alkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

und gegebenenfalls an den so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition weitere Umwandlungen nach üblichen Methoden durchgeführt werden.

6. Verfahren zum Bekämpfen von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, dass man mindestens eine Verbindung gemäß einem der

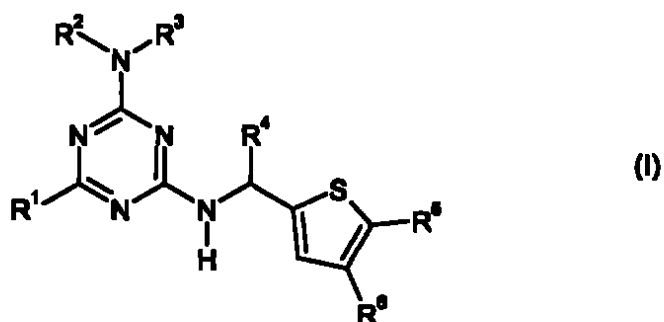
Ansprüche 1 bis 4 auf unerwünschte Pflanzen und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.

- 5 7. Verwendung von mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 zum Bekämpfen von unerwünschten Pflanzen.
8. Herbizides Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 und üblichen Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln.

10

Substituierte Thienylalkylamino-1,3,5-triazine**Zusammenfassung**

Die vorliegende Erfindung betrifft neue substituierte Thienylalkylamino-1,3,5-triazine der allgemeinen Formel (I)



in welcher

R^1, R^2, R^3, R^4 die in der Beschreibung angegebene Bedeutung besitzen,

R^5 für Chlor oder Methyl steht und

R^6 für Chlor oder Methyl steht,

wobei die Substituenten an dem Kohlenstoffatom, an welches R^4 gebunden ist, im wesentlichen entweder in R-Konfiguration oder in S-Konfiguration angeordnet sind. Die Erfindung betrifft auch die zugehörigen Racemate sowie ein Verfahren zur Herstellung aller erfindungsgemäßen Verbindungen und deren Verwendung als Herbizide.

TRADUCCION: Se traduce la carátula, la descripción y las reivindicaciones anexas a una copia de la solicitud de patente Alemana No. 199 62 931.5 escrita en Alemán, para el invento denominado: **TENILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS.**

REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

(emblema)

**CERTIFICADO DE PRIORIDAD REFERENTE A LA PRESENTACION DE UNA SOLICITUD DE
PATENTE**

Expediente No. : 199 62 931.5
Fecha de presentación : 24 DE DICIEMBRE DE 1999
Nombre del Solicitante : BAYER ASKTIENGESELLSCHAFT
Leverkusen/Alemania.
Título del Invento : **TENILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS
SUBSTITUIDAS .**
Clasificación : C07D, A01N

Las piezas anexas son una reproducción fiel y exacta de la documentación original de esta solicitud.

Munich, el día 21 de Septiembre de 2000
OFICINA ALEMANA DE PATENTES Y MARCA
El Presidente
Por Delegación

((firma ilegible))
Nietfeldt

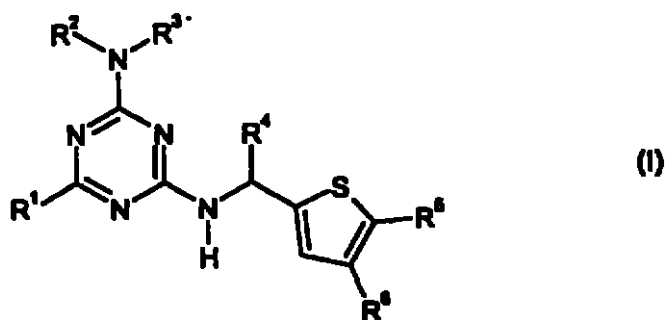
Cinta tricolor y Sello de Oblea

TIENILALQUILAMINO-1,3,5-TRIAZINAS SUBSTITUIDAS.

La invención se refiere a nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas, al procedimiento para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se conoce ya una serie de tienilalquilamino-1,3,5-triazinas por la literatura (de patentes) (véanse las publicaciones JP-A-63222166 - citada en Chem. Abstracts 111:97288w, WO-A-98/15537, WO-A-98/15538, WO-A-98/15539, WO-A-99/18100). Sin embargo estos compuestos no han adquirido hasta ahora ningún significado especial.

Se han encontrado ahora las nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I)



en la que

R¹ significa dihalógenometilo, etilo, halógenoetilo, dihalógenoetilo, n-propilo, halógeno-n-propilo, dihalógeno-n-propilo, i-propilo, halógeno-i-propilo, dihalógeno-i-propilo, halógenociclopropilo, dihalógenociclopropilo o trihalógenociclopropilo,

R² significa hidrógeno o significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,

- R³** significa hidrógeno, significa formilo o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propil-aminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R⁴** significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R⁵** significa cloro o metilo y
- R⁶** significa cloro o metilo,

estando dispuestos los substituyentes sobre el átomo de carbono, con el cual está enlazado R⁴, fundamentalmente bien en configuración R o en configuración S, así como también los racematos correspondientes.

En tanto en cuanto R¹ signifique un substituyente con un átomo de carbono substituido de manera asimétrica, constituyen el objeto de la invención tanto las correspondientes mezclas posibles de diastereómeros así como los diastereómeros individuales posibles.

Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos presentes en las fórmulas anteriormente citadas y que se citarán a continuación, se describen a continuación.

Preferentemente,

- R¹** significa difluórmétilo, diclorométilo, dibromométilo, clorofluórmétilo, cloro-bromométilo, flúorbromométilo, etilo, flúoretilo, cloroetilo, bromoetilo, difluoretilo, dicloroetilo, dibromoetilo, clorofluoretilo, bromofluoretilo, n-propilo, flúor-n-propilo, cloro-n-propilo, bromo-n-propilo,

difluór-n-propilo, dicloro-n-propilo, i-propilo, fluór-i-propilo, cloro-i-propilo. bromo-i-propilo. difluór-i-propilo. dicloro-i-propilo, fluórciclopropilo, clorociclopropilo. difluórciclopropilo, diclorociclopropilo, difluórciclopropilo, triclorociclo-propilo, clorodifluórciclopropilo o fluórdiclorociclopropilo.

Preferentemente,

R² significa hidrógeno o significa metilo o etilo substituídos en caso dado por ciano, por fluór, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente,

R³ significa hidrógeno, significa formilo o significa metilo, etilo, acetilo, propio-nilo, n- o i-buti-roilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxi-carbo-nilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbo-nilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por fluór, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por fluór, por cloro, por metoxi o por etoxi.

Preferentemente,

R⁵ significa cloro o metilo.

Preferentemente,

R⁶ significa cloro o metilo.

De forma especialmente preferente,

R¹ significa difluórmétilo, diclorométilo, dibromométilo, clorofluórmétilo, etilo, 1-fluór-etilo, 2-fluór-etilo, 1-cloro-etilo, 2-cloro-etilo, 1-bromo-etilo, 2-bromo-etilo, 1,1-difluór-etilo, 1,2-difluór-etilo, 2,2-difluór-etilo, 1,1-

-5-

dicloro-etilo, 1.2-dicloro-etilo, 2.2-dicloro-etilo, 1.2-dibromo-etilo, 1-cloro-1-flúor-etilo, 1-cloro-2-flúor-etilo, 2-cloro-1-flúor-etilo, 2-cloro-2-flúor-etilo, 1-flúor-n-propilo, 2-flúor-n-propilo, 1-cloro-n-propilo, 2-cloro-n-propilo, 1-bromo-n-propilo, 2-bromo-n-propilo, 1-flúor-i-propilo, 1-cloro-i-propilo, diflúorciclo-propilo o diclorociclopropilo.

De forma especialmente preferente,

R² significa hidrógeno, metilo o etilo.

De forma especialmente preferente,

R³ significa hidrógeno, significa formilo, significa metilo o etilo, o significa acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁵ significa cloro o metilo.

De forma especialmente preferente,

R⁶ significa cloro o metilo.

De forma muy especialmente preferente.

R¹ significa diflúormetilo, diclorometilo, cloroflúormetilo, etilo, 1-flúor-etilo, 1-cloro-etilo, 1,1-diflúor-etilo, 1,2-diflúor-etilo, 1,1-dicloroetilo, 1,2-dicloro-etilo, 1-cloro-1-flúoretilo, 1-cloro-2-flúor-etilo, 2-cloro-1-flúor-etilo, 1-flúor-n-propilo, 1-cloro-n-propilo, 1-flúor-i-propilo o 1-cloro-i-propilo.

De forma muy especialmente preferente.

R² significa hidrógeno.

De forma muy especialmente preferente.

R³ significa hidrógeno, significa formilo o significa acetilo, propionilo, n- o i-butirole, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor,, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente.

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro.

De forma my especialmente preferente,

R⁵ significa cloro.

De forma muy especialmente preferente.

R⁶ significa metilo.

Las definiciones de los restos indicadas anteriormente de manera general o citadas en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para los respectivos productos de partida o productos intermedios necesarios para la obtención. Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los intervalos preferentes indicados.

Según la invención son preferentes aquellos restos de la fórmula (I), en los cuales se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera preferente.

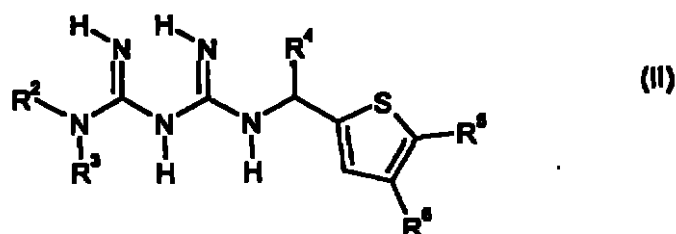
Según la invención son especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I), en los cuales se presenta una combinación de los significados indicados

anteriormente de manera especialmente preferente.

Según la invención son muy especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I), en los cuales se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente de manera muy especialmente preferente.

Las nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I) presentan propiedades biológicas interesantes. Se caracterizan, especialmente, por una potente actividad herbicida.

Se obtienen las nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I), si se hacen reaccionar biguanidas de la fórmula general (II)



en la que

R², R³, R⁴, R⁵, y R⁶ tienen el significado anteriormente indicado.

- y/o con ácidos de los compuestos de la fórmula general (II)-

con compuestos de alcóxicarbonilo de la fórmula general (III)



en la que

R¹ tiene el significado anteriormente indicado y

R' significa alquilo,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en

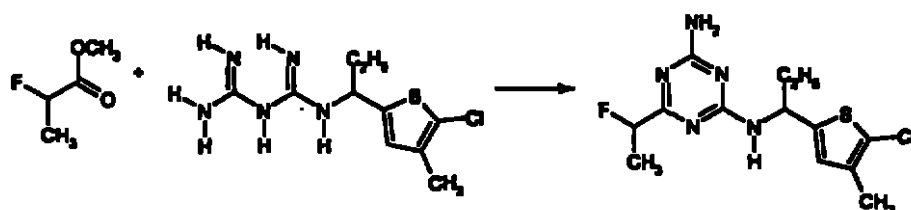
presencia de un diluyente,

y en caso dado se llevan a cabo en los compuestos, obtenidos de este modo, de la

-8-

fórmula general (I). en el ámbito de la definición de los sustituyentes. otras transformaciones según métodos usuales.

Si se emplean, por ejemplo, la 1-(5-cloro-4-metil-tien-2-il-propil)-biguanida y el 2-flúor-propanoato de metilo como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el procedimiento según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Las biguanidas, a ser empleadas como productos de partida en el procedimiento según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidas en general por medio de la fórmula (II). En la fórmula general (II), R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de forma preferente o bien de forma especialmente preferente para R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula general (I).

Los aductos con ácido adecuados de los compuestos de la fórmula (II) son sus productos de adición con ácidos protónicos, tal como, por ejemplo, con ácido clorhídrico (cloruro de hidrógeno), ácido bromhídrico (bromuro de hidrógeno), ácido sulfúrico, ácido metanosulfónico, ácido bencenosulfónico y ácido p-toluenosulfónico.

Los productos de partida de la fórmula general (II) son conocidos y/o

pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las JP-A-63222166, WO-A-99/18100).

Los compuestos de alcóxicarbonilo, a ser empleados además como productos de partida en el procedimiento según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (III). En la fórmula general (III), R¹ tiene preferentemente o bien especialmente aquel significado que ya ha sido citado anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para R¹ en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula general (I); preferentemente R¹ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, especialmente significa metilo o etilo.

Los productos de partida de la fórmula general (III) son productos químicos para síntesis conocidos.

El procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se lleva a cabo, preferentemente, con empleo de un diluyente. Como diluyentes para la realización del procedimiento según la invención entran en consideración, además de agua, ante todo disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, especialmente, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como, por ejemplo, bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres tales como dietiléter, diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano o etilenglicoldimetil- o -dietil-éter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutilcetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo o butironitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona

o hexametilfós-forotriamida: ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxido, tal como dimetilsulfóxido, alcoholes tales como metanol, etanol, n- o i-propanol, etilenglicolmonometiléter, etilenglicolmonoetiléter, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o agua pura.

Como agentes auxiliares de la reacción para el procedimiento según la invención entran en consideración en general las bases o aceptores de ácido inorgánicos u orgánicos usuales. A éstos pertenecen, preferentemente, acetatos, amidas, carbonatos, bicarbonatos, hidruros, hidróxidos o alcanolatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como, por ejemplo, acetato de sodio, de potasio o de calcio, amida de litio, de sodio, de potasio o de calcio, carbonato de sodio, de potasio o de calcio, bicarbonato de sodio, de potasio o de calcio, hidruro de litio, de sodio, de potasio o de calcio, hidróxido de litio, de sodio, de potasio o de calcio, metanolato, etanolato, n- o i-propanolato, n-, i-, s- o t-butanolato de sodio o de potasio, además también compuestos nitrogenados básicos tales como, por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropil-amina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, diciticlohexilamina, etil-diciticlohexilamina, N,N-dimetil-anilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetil-piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilamino-piridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]-octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]-non-5-eno (DBN), o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-undec-7-eno (DBU).

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C, preferentemente entre 10°C y 120°C.

El procedimiento según la invención se lleva a cabo, en general, bajo presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo el procedimiento según la invención bajo presión mas elevada o a presión mas reducida -en general comprendida entre 0,1 bar y 10 bares-.

Para la realización del procedimiento según la invención se emplean los productos de partida, en general, en cantidades aproximadamente equimolares. No obstante es posible también emplear uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se lleva a cabo, en general, en un diluyente adecuado, en presencia de un agente auxiliar de la reacción y la mezcla de la reacción se agita, en general, durante varias horas a la temperatura necesaria. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. (véanse los ejemplos de obtención.

Los productos activos según la invención se pueden emplear como defoliantes, desecantes, agentes herbicidas y especialmente como agentes para eliminar las malas hierbas. Por malas hierbas, en el más amplio sentido, se han de entender las plantas que crecen en lugares donde son indeseadas. El hecho de que las sustancias, según la invención, actúen como herbicidas totales o selectivos, depende esencialmente de la cantidad empleada

Los productos activos según la invención pueden emplearse por ejemplo en las plantas siguientes:

Malas hierbas dicotiledóneas de las clases: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus,

Rorippa. Rotala. Rumex. Salsola. Senecio. Seshania. Sida. Sinapis, Solanum. Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica. Viola, Xanthium.

Cultivos dicotiledóneos de las clases: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita. Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Malas hierbas monocotiledóneas de las clases: Aegilops, Agropyron, Agrostis. Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus. Commelina, Cynodon. Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa. Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia. Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Cultivos monocotiledóneos de las clases: Allium, Ananas, Asparagus, Avena. Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

El empleo de los productos activos según la invención, no está sin embargo, limitado en forma alguna estas clases, sino que se extienden en igual forma también sobre otras plantas.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres desecadas y no desecadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las

plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimiento con una o varias capas.

Los productos activos según la invención son adecuados, en función de la concentración, para combatir totalmente las hierbas malas, por ejemplo, en instalaciones industriales y viarias y en caminos y plazas, con y sin crecimiento de árboles. Del mismo modo, se pueden emplear los compuestos para combatir las hierbas malas en cultivos permanentes, por ejemplo, en instalaciones forestales, de árboles de adorno, de árboles frutales, de viñedos, de árboles cítricos, de nogales, de plátanos, de café, de té, de goma de palmas de aceite, de cacao, de frutos de bayas y de lúpulo, sobre trazados ornamentales y deportivos y en superficies de prados y para combatir las hierbas malas en forma selectiva en los cultivos mono-anales.

Los compuestos según la invención de la fórmula (I) muestran una potente actividad herbicida y un amplio espectro de actividad sobre el terreno y sobre las partes aéreas de las plantas. Son adecuados en cierta medida también para combatir de manera selectiva las malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en cultivos monocotiledóneos y dicotiledóneos, tanto en el procedimiento de pre-brote como en

el procedimiento de post-brote.

Los productos activos se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos pulverizables, suspensiones, polvos, medios de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como micro-encapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo, mediante mezcla de los productos activos con materiales extendedores, esto es, con disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado, empleando agentes tensioactivos, esto es, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

En el caso de emplear agua como material de carga se puede emplear, por ejemplo, también disolventes orgánicos como agentes disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran especialmente en consideración: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobenzenos, clometilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o las parafinas, por ejemplo, las fracciones de petróleo crudo, los aceites minerales y vegetales, los alcoholes tales como butanol, o glicol, así como sus ésteres y éteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutylcetona, o ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales molturados, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales sintéticos molturados, tales como ácido silícico, altamente disperso, óxido de aluminio

y silicatos. como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo. minerales naturales quebrados y fraccionados tales como calcita, mármol. piedra pómez. sepiolita. dolomita. así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de materiales orgánicos, tales como serrines. cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo, los emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilenados de ácidos grasos, éteres polioxietilenados de alcoholes grasos, tales como por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina: como dispersantes entran en consideración: por ejemplo. lixiviaciones sulfíticas de lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden emplear adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de latex. tales como goma arábica. alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden emplear colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo. óxido de hierro. óxido de titanio, azul ferrocianico y colorantes orgánicos. tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y de ftalocianina metálicos y nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, por lo general, entre un 0,1 hasta un 95 % en peso de producto activo, preferentemente entre un 0,5 y un 90 %.

Los productos activos según la invención pueden encontrar aplicación como tales o en sus formulaciones también en mezcla con herbicidas conocidos para la

lucha contra las malas hierbas, siendo posibles preparados listos para su empleo o mezclas de tanque.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo:

Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxymid(-sodio), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodio), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlormethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop(-propargilo), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron (-metilo), Cloransulam(-metilo), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclofop(-metilo), Diclosulam, Diethatyl(-etilo), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-metilo), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-etilo), Fentrazamide, Flamprop(-isopropilo), Flamprop(-isopropilo-L), Flamprop(-metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-etilo), Flupoxam, Flupropacil, Flupyrasulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-metilo), Fluthiamide,

Fomesafen. Glufosinate(-amonio). Glyphosate(-isopropilamonio). Halosafen. Haloxypol(-etoxietilo). Haloxypol(-P-metilo). Hexazinone, Imazamethabenz(-metilo). Imazamethapyr. Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr. Imazosulfuron, Iodosulfuron(-metilo, -sodio), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alfa-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron. Metribuzin. Metsulfuron(-metilo), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Nehuron, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, ácido pelargónico, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor. Primisulfuron(-metilo), Prometryn, Propachlor. Propanil. Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-etilo), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxysen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-metilo), Pyriithiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo), Quizalofop(-P-terfurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate, Sulfosulfuron. Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-metilo), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin y Triflusulfuron.

También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, sustancias protectoras contra la ingestión por pájaros, sustancias nutrientes de las plantas y medios mejoradores de la estructura del terreno.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de los mismos mediante diluciones ulteriores, tales como soluciones listas para su empleo, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y granulados. El empleo se lleva a cabo en forma usual por ejemplo mediante riego, pulverización, aspersión, esparcido.

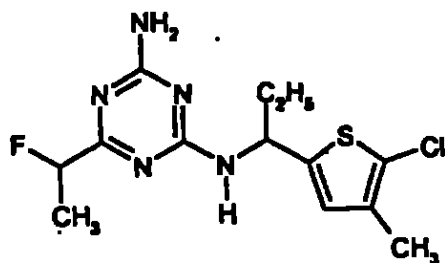
Los productos activos según la invención pueden aplicarse tanto antes como después del brote de las plantas. También pueden incorporarse, en el suelo antes de la siembra.

La cantidad de producto activo empleada puede oscilar dentro de un amplio margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. En general las cantidades empleadas se sitúa entre 1 g y 10 kg de producto activo por hectárea de superficie del terreno, preferentemente entre 5 g y 5 kg por hectárea.

La obtención y el empleo de las sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

Ejemplos de obtención:

Ejemplo 1.



Se agitan durante 18 horas a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) una mezcla constituida por 1,1 g (20 mmoles) de metilato de sodio, 6,2 g (20 mmoles) de 1-[1-(5-cloro-4-metil-tien-2-il)-propil]-biguanida, 2,4 g (20 mmoles) de 2-flúor-propa-noato de metilo y 30 ml de metanol. A continuación se diluye con cloruro

de metileno (aproximadamente 1:1 en volumen) hasta un volumen aproximadamente cinco veces mayor y se sacude perfectamente. La fase orgánica se separa, se seca con sulfato de sodio y se filtra. El disolvente se elimina cuidadosamente por destilación del filtrado bajo presión reducida.

Se obtienen 1,5 g (23 % de la teoría) de la 6-(1-flúor-etil)-N²-[1-(5-cloro-4-metil-2-tienil)-propil]-1,3,5-triazin-2,4-diamina en forma de residuo amorfo.

logP (a pH = 2,3): 2,47.

De manera análoga a la del ejemplo 1 así como de acuerdo con la descripción general del procedimiento de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla 1 siguiente.

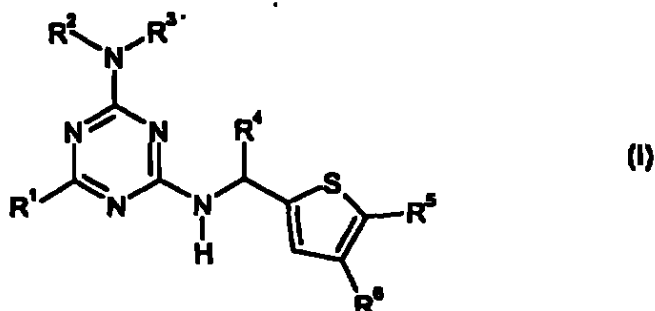
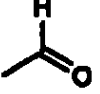
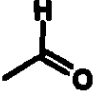
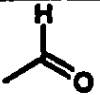
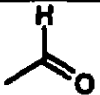
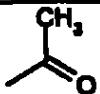
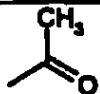
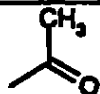
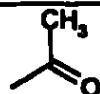
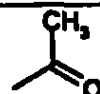
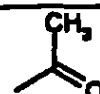


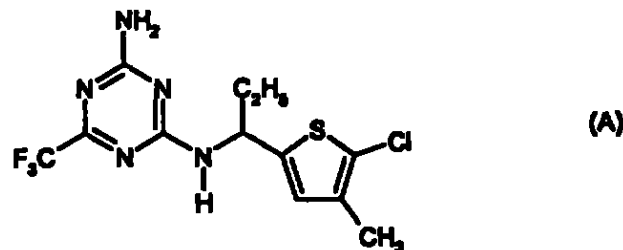
Tabla I: Ejemplo para los compuestos de la fórmula I.

Ej. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Datos físicos
2	C ₂ H ₅	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 1,92 ^{aj}
3	CF(CH ₃) ₂	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 2,49 ^{aj}
4	CHCl ₂	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 3,56 ^{aj}
5	CHF ₂	H	H	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	logP = 3,04 ^{aj}
6	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Fp.: 58°C
7	CHFCH ₃	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Fp.: 64°C
8	CF(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Fp.: 52°C
9	C ₂ H ₅	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
10	CHFCH ₃	H		CH ₃	Cl	CH ₃	

Ej. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Datos físicos
11	CF(CH ₃) ₂	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
12	C ₂ H ₅	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
13	CHFCH ₃	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
14	CF(CH ₃) ₂	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
15	C ₂ H ₅	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
16	CHFCH ₃	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
17	CF(CH ₃) ₂	H		CH ₃	Cl	CH ₃	
18	C ₂ H ₅	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
19	CHFCH ₃	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	
20	CF(CH ₃) ₂	H		C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	

Ejemplos de aplicación:

En algunos de los ejemplos de aplicación siguientes se utiliza como substancia comparativa el compuesto conocido siguiente:



N²-[1-(5-cloro-4-metil-2-tienil)-propil]-6-trifluormetil-1,3,5-tiazin-2,4-diamina
(conocido por la JP-A-63222166)

Ejemplo A.

Ensayo pre-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicóler.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se siembran en terreno normal semillas de las plantas de ensayo. Al cabo de 24 horas, aproximadamente, se pulveriza el suelo con la preparación del producto activo de tal manera que se aplique, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada por unidad de superficie. La concentración del caldo de pulverización se elegirá de tal modo que se aplique en 1.000 litros de agua por hectárea, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo del control no tratados.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles no tratados).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 3, y 5, parcialmente con una buena compatibilidad para con las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, maíz, un efecto notablemente mas potente contra las malas hierbas que el del compuesto conocido (A).

Ejemplo B.

Ensayo de post-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se pulverizan, con la preparación del producto activo, plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm, de tal manera que, se apliquen respectivamente las cantidades de producto activo deseadas por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elige de tal forma que se aplique en 1.000 litros de agua/ha la cantidad deseada en cada caso de producto activo.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo de los controles sin tratar.

Significan:

7/3
100

-24-

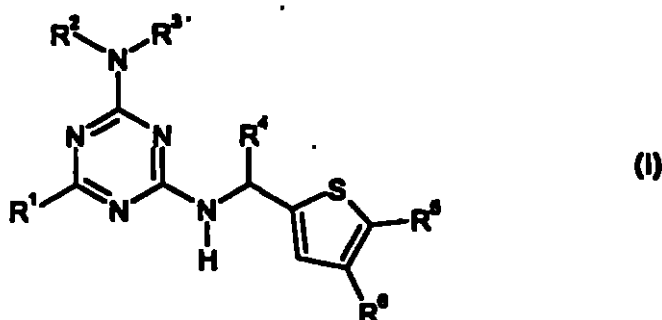
0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1, 2, 3, 4 y 5, parcialmente con una buena compatibilidad parcialmente frente a las plantas de cultivo, tal como, por ejemplo, maíz, un potente efecto contra las malas hierbas.

REIVINDICACIONES

1.- Compuestos de la fórmula general (I)



en la que

- R¹** significa dihalógenometilo, etilo, halógenoetilo, dihalógenoetilo, n-propilo, halógeno-n-propilo, dihalógeno-n-propilo, i-propilo, halógeno-i-propilo, dihalógeno-i-propilo, halógenociclopropilo, dihalógenociclopropilo o trihalógenociclopropilo,
- R²** significa hidrógeno o significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R³** significa hidrógeno, significa formilo o significa metilo, etilo, n- o i-propilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R⁴** significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi,
- R⁵** significa cloro o metilo y

R⁶ significa cloro o metilo,

estando dispuestos los substituyentes sobre el átomo de carbono, con el cual está enlazado **R⁴**, fundamentalmente bien en configuración R o en configuración S, así como también los racematos correspondientes.

2.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

R¹ significa difluórmethyl, dicloromethyl, dibromomethyl, clorofluórmethyl, clorobromomethyl, flúorbromomethyl, etilo, flúoretilo, cloroetilo, bromoetilo, difluoretilo, dicloroetilo, dibromoetilo, clorofluoretilo, bromofluoretilo, n-propilo, flúor-n-propilo, cloro-n-propilo, bromo-n-propilo, difluor-n-propilo, dicloro-n-propilo, i-propilo, flúor-i-propilo, cloro-i-propilo, bromo-i-propilo, difluor-i-propilo, dicloro-i-propilo, flúorciclopropilo, clorociclopropilo, difluorciclopropilo, diclorociclopropilo, difluorciclopropilo, triclорociclopropilo, clorodifluorciclopropilo o flúordiclorociclopropilo,

R² significa hidrógeno o significa metilo o etilo substituidos en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R³ significa hidrógeno, significa formilo o significa metilo, etilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirol, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R⁵ significa cloro o metilo y

R⁶ significa cloro o metilo.

3.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

- R¹ significa difluórmethyl, dicloromethyl, dibromomethyl, clorofluórmethyl, etilo, 1-flúor-etilo, 2-flúor-etilo, 1-cloro-etilo, 2-cloro-etilo, 1-bromo-etilo, 2-bromo-etilo, 1,1-difluóor-etilo, 1,2-difluóor-etilo, 2,2-difluóor-etilo, 1,1-dicloro-etilo, 1,2-dicloro-etilo, 2,2-dicloro-etilo, 1,2-dibromo-etilo, 1-cloro-1-flúoretilo, 1-cloro-2-flúor-etilo, 2-cloro-1-flúor-etilo, 2-cloro-2-flúor-etilo, 1-flúor-n-propilo, 2-flúor-n-propilo, 1-cloro-n-propilo, 2-cloro-n-propilo, 1-bromo-n-propilo, 2-bromo-n-propilo, 1-flúor-i-propilo, 1-cloro-i-propilo, difluóorciclopropilo o diclorociclopropilo,
- R² significa hidrógeno, metilo o etilo,
- R³ significa hidrógeno, significa formilo, significa metilo o etilo, o significa acetilo, propionilo, n- o i-butirol, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,
- R⁴ significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,
- R⁵ significa cloro o metilo y
- R⁶ significa cloro o metilo.

4.- Compuestos según la reivindicación 1, caracterizados porque

- R¹ significa difluórmethyl, dicloromethyl, clorofluórmethyl, etilo, 1-flúor-etilo, 1-cloro-etilo, 1,1-difluóor-etilo, 1,2-difluóor-etilo, 1,1-dicloroetilo, 1,2-dicloroetilo, 1-cloro-1-flúoretilo, 1-cloro-2-flúor-etilo, 2-cloro-1-flúor-etilo, 1-flúor-n-propilo, 1-cloro-n-propilo, 1-flúor-i-propilo o 1-cloro-i-propilo,
- R² significa hidrógeno,

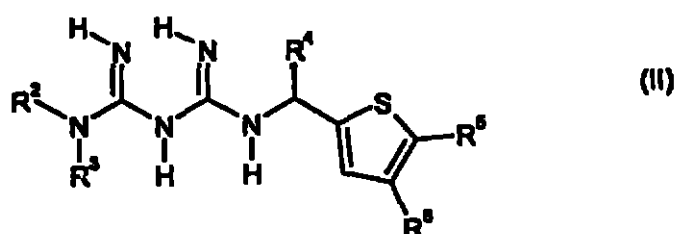
R^3 significa hidrógeno, significa formilo o significa acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi,

R^4 significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor o por cloro,

R^5 significa cloro y

R^6 significa metilo.

5.- Procedimiento para la obtención de compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque se hacen reaccionar compuestos de la fórmula general (II)



en la que

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 tienen los significados indicados en una de las reivindicaciones 1 a 4,

-y/o aductos con ácidos de los compuestos de la fórmula general (II)-
con compuestos de alcoxycarbonilo de la fórmula general (III)



en la que

R^1 tiene el significado indicado en una de las reivindicaciones 1 a 4 y

R^1 significa alquilo,

en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

y, en caso dado se llevan a cabo en los compuestos, obtenidos de este modo, de la fórmula general (I), en el ámbito de la definición de los sustituyentes, otras transformaciones según métodos usuales.

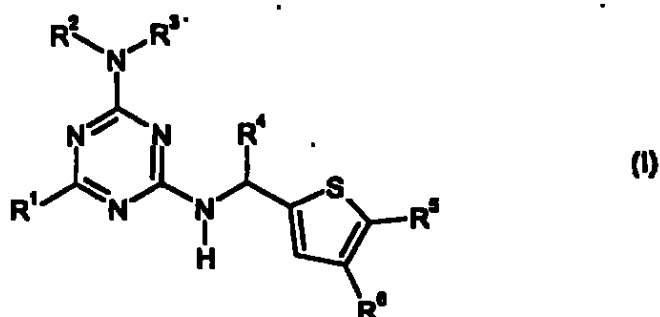
6.- Procedimiento para la lucha contra el crecimiento indeseable de las plantas, caracterizado porque se deja actuar sobre las plantas indeseables y/o sobre su medio ambiente al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4.

7.- Empleo de al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4, para la lucha contra las plantas indeseables.

8.- Agente herbicida, caracterizado porque tiene un contenido en un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4, y extendedores y/o agentes tensioactivos usuales.

RESUMEN

La presente invención se refiere a nuevas tienilalquilamino-1,3,5-triazinas substituidas de la fórmula general (I),



en la que

R¹, R², R³, R⁴, tienen el significado indicado en la descripción,

R⁵ significa cloro o metilo y

R⁶ significa cloro o metilo,

estando dispuestos los substituyentes en el átomo de carbono, con el cual está enlazado R⁴, fundamentalmente bien en configuración R o en configuración S. La invención se refiere también a los racematos correspondientes así como a un procedimiento para la obtención de todos los compuestos según la invención y a su empleo como herbicidas.

770
102

SUPERINTENDENCIA Y LICENCIAMIENTO
Radicacion : 00007423 00300000 Folios: 110
Fecha (CIB): 2000-12-22 16:42:34
Tramite : 002 PATENTES D 1 RESULTADO/ 411 PRESENTAR
Dependencia: 2020 DIVISION DE BIENES CHENAJOCES

NIT : 000176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 71,564
FECHA : NOVIEMBRE 20 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	2825220	16,327,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. CONTABILISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	608,000.
	TOTAL :	\$ 608,000.00

SOM: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

66 0000-801-16-4

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

PATENTE DE INVENCION [☒]

MODELO DE UTILIDAD [☐]

- Indicación de que se solicita la concesión de una patente [☐]
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [☐]
- Descripción de la invención [☐]
- Dibujos de ser estos pertinentes [☐]
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas [☐]

COMPLETA [☒]

INCOMPLETA [☐]

DISEÑO INDUSTRIAL [☐]

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial [☐]
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud. [☐]
- Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño. [☐]
- Comprobante de pago de las tasas establecidas. [☐]

COMPLETA [☐]

INCOMPLETA [☐]

ESQUEMA DE TRAZADO [☐]

- Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de trazado. [☐]
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud. [☐]
- Representación gráfica del esquema de trazado [☐]
- Comprobante de pago de las tasas establecidas. [☐]

COMPLETA [☐]

INCOMPLETA [☐]

Firma Responsable

Fecha:

2020
Bogotá, DC

Doctor
EMILIO FERRERO
Apoderado

REFERENCIA:	Radicación No.	00-97423
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio No.	0824
	Folios	001

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica que:

- Debe allegar copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente otorgado por el inventor al solicitante o a su causante (art. 28-k, Dec 486/2000).

- El interesado debe informar la dirección del solicitante, debido a que en la solicitud no aparece la misma. (Art. 27-b, D 486/00).

En cumplimiento del artículo 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le requiere para que dentro del término de dos (2) meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el artículo 8 de la Resolución Reglamentaria No. 210 del 15 de enero del 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

15 MAR. 2001

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha _____.

202027/202022

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 382 2695
E-mail: info@sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia